

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2013-542215

(P2013-542215A)

(43) 公表日 平成25年11月21日(2013.11.21)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C07D 231/16 (2006.01)	C07D 231/16	4C063
A61P 31/04 (2006.01)	A61P 31/04	4C086
C07D 405/12 (2006.01)	C07D 405/12 CSP	4H011
C07D 401/12 (2006.01)	C07D 401/12	
C07D 403/12 (2006.01)	C07D 403/12	

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 87 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2013-535465 (P2013-535465)
 (86) (22) 出願日 平成23年11月2日 (2011.11.2)
 (85) 翻訳文提出日 平成25年6月26日 (2013.6.26)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2011/069206
 (87) 国際公開番号 W02012/059497
 (87) 国際公開日 平成24年5月10日 (2012.5.10)
 (31) 優先権主張番号 61/472, 374
 (32) 優先日 平成23年4月6日 (2011.4.6)
 (33) 優先権主張国 米国 (US)
 (31) 優先権主張番号 10356030.6
 (32) 優先日 平成22年11月2日 (2010.11.2)
 (33) 優先権主張国 欧州特許庁 (EP)

(71) 出願人 512151078
 バイエル・インテレクチュアル・プロパテ
 イー・ゲー・エム・ベー・ハー
 ドイツ国、40789・モンハイム、アル
 フレートーノベルーシュトラッセ・10
 (74) 代理人 100146318
 弁理士 岩瀬 吉和
 (74) 代理人 100114188
 弁理士 小野 誠
 (74) 代理人 100119253
 弁理士 金山 賢教
 (74) 代理人 100124855
 弁理士 坪倉 道明
 (74) 代理人 100129713
 弁理士 重森 一輝

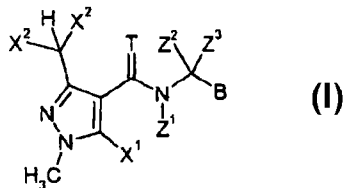
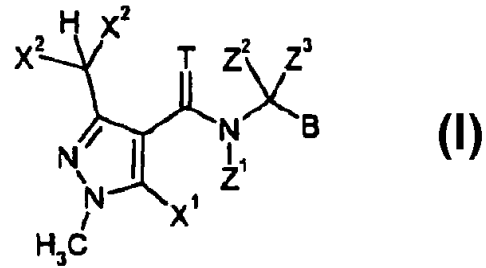
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 N-ヘタリールメチルピラゾリルカルボキサミド類

(57) 【要約】

本発明は、N-ヘタリールメチルピラゾリルカルボキサミド誘導体又はそれらのチオカルボキサミド誘導体、それらを調製する方法、殺菌剤としてのそれらの使用、特に、組成物の形態における殺菌剤としてのそれらの使用、並びに、それら化合物又は組成物を使用して植物病原性菌類（特に、植物の植物病原性菌類）を防除する方法に関する。

【化1】

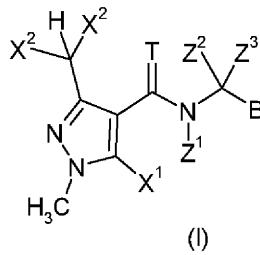


【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1】



10

〔式中、

・ T は、O 又は S を表し；
 ・ X^1 及び X^2 (ここで、 X^1 及び X^2 は、同一であるか又は異なっていることが可能である) は、塩素原子又はフッ素原子を表し；

・ Z^1 は、水素原子、置換されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_8$ - アルキル；置換されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_8$ - アルコキシ；置換されているか若しくは置換されていない $C_2 - C_8$ - アルケニル；置換されているか若しくは置換されていない $C_2 - C_8$ - アルキニル；置換されているか若しくは置換されていない $C_3 - C_7$ - シクロアルキル；置換されているか若しくは置換されていない $C_3 - C_7$ - シクロアルキル - $C_1 - C_8$ - アルキル；置換されているか若しくは置換されていない 3 - オキセタニル；又は、置換されているか若しくは置換されていない 3 - チエタニルを表し；

20

・ Z^2 及び Z^3 (ここで、 Z^2 及び Z^3 は、同一であるか又は異なっていることが可能である) は、水素原子；置換されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_8$ - アルキル；置換されているか若しくは置換されていない $C_2 - C_8$ - アルケニル；置換されているか若しくは置換されていない $C_2 - C_8$ - アルキニル；シアノ；イソニトリル；ニトロ；ハロゲン原子；置換されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_8$ - アルコキシ；置換されているか若しくは置換されていない $C_2 - C_8$ - アルケニルオキシ；置換されているか若しくは置換されていない $C_2 - C_8$ - アルキニルオキシ；置換されているか若しくは置換されていない $C_3 - C_7$ - シクロアルキル；置換されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_8$ - アルキルスルファニル；置換されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_8$ - アルキルスルホニル；置換されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_8$ - アルキルスルフィニル；アミノ；置換されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_8$ - アルキルアミノ；置換されているか若しくは置換されていないジ - $C_1 - C_8$ - アルキルアミノ；置換されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_8$ - アルコキシカルボニル；置換されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_8$ - アルキルカルバモイル；置換されているか若しくは置換されていないジ - $C_1 - C_8$ - アルキルカルバモイル；又は、置換されているか若しくは置換されていない N - $C_1 - C_8$ - アルキル - $C_1 - C_8$ - アルコキシ - カルバモイルを表し；又は、

30

40

・ Z^2 と Z^3 は、それらが結合している炭素原子と一緒に、置換されているか又は置換されていない $C_3 - C_7$ - シクロアルキルを形成し；又は、

・ Z^3 と B 基への結合点に隣接している置換基 X は、それらが結合している連続した炭素原子と一緒に、置換されているか又は置換されていない 5 員、6 員又は 7 員の部分的飽和の炭素環又はヘテロ環 (ここで、該ヘテロ環は、3 個以下のヘテロ原子を含んでいる) を形成し、及び、 Z^2 は、上記で記載されているとおりであり；

・ B は、同一であるか又は異なっていることが可能な 6 以下の基 X で置換され得る飽和又は部分的飽和又は不飽和の単環式又は縮合二環式の 4 員、5 員、6 員、7 員、8 員、9 員又は 10 員の環 (ここで、該環は、N、O、S からなるリストの中で選択される 1 個

50

から4個までのヘテロ原子を含んでいる)を表し[但し、Bは、2-ピリジル環ではなく、また、Bは、Z¹が置換されているか又は置換されていないシクロプロピル基を表す場合には、1,3-ベンゾジオキサソリル環ではない];

・ Xは、ハロゲン原子;ニトロ;シアノ;イソニトリル;ヒドロキシ;アミノ;スルファニル;ペンタフルオロ-⁶-スルファニル;ホルミル;ホルミルオキシ;ホルミルアミノ;置換されているか若しくは置換されていない(ヒドロキシイミノ)-C₁-C₈-アルキル;置換されているか若しくは置換されていない(C₁-C₈-アルコキシイミノ)-C₁-C₈-アルキル;置換されているか若しくは置換されていない(C₂-C₈-アルケニルオキシイミノ)-C₁-C₈-アルキル;置換されているか若しくは置換されていない(C₂-C₈-アルキニルオキシイミノ)-C₁-C₈-アルキル;置換されているか若しくは置換されていない(ベンジルオキシイミノ)-C₁-C₈-アルキル;カルボキシ;カルバモイル;N-ヒドロキシカルバモイル;カルバメート;置換されているか若しくは置換されていないC₁-C₈-アルキル;1~5個のハロゲン原子を有しているC₁-C₈-ハロゲノアルキル;置換されているか若しくは置換されていないC₂-C₈-アルケニル;1~5個のハロゲン原子を有しているC₂-C₈-ハロゲノアルケニル;置換されているか若しくは置換されていないC₂-C₈-アルキニル;1~5個のハロゲン原子を有しているC₂-C₈-ハロゲノアルキニル;置換されているか若しくは置換されていないC₁-C₈-アルコキシ;1~5個のハロゲン原子を有しているC₁-C₈-ハロゲノアルコキシ;置換されているか若しくは置換されていないC₁-C₈-アルキルスルファニル;1~5個のハロゲン原子を有しているC₁-C₈-ハロゲノアルキルスルファニル;置換されているか若しくは置換されていないC₁-C₈-アルキルスルフィニル;1~5個のハロゲン原子を有しているC₁-C₈-ハロゲノアルキルスルフィニル;置換されているか若しくは置換されていないC₁-C₈-アルキルスルホニル;1~5個のハロゲン原子を有しているC₁-C₈-ハロゲノアルキルスルホニル;置換されているか若しくは置換されていないC₁-C₈-アルキルアミノ;置換されているか若しくは置換されていないジ-C₁-C₈-アルキルアミノ;置換されているか若しくは置換されていないC₂-C₈-アルケニルオキシ;1~5個のハロゲン原子を有しているC₂-C₈-ハロゲノアルケニルオキシ;置換されているか若しくは置換されていないC₃-C₈-アルキニルオキシ;1~5個のハロゲン原子を有しているC₂-C₈-ハロゲノアルキニルオキシ;置換されているか若しくは置換されていないC₃-C₇-シクロアルキル;1~5個のハロゲン原子を有しているC₃-C₇-ハロゲノシクロアルキル;置換されているか若しくは置換されていない(C₃-C₇-シクロアルキル)-C₁-C₈-アルキル;置換されているか若しくは置換されていない(C₃-C₇-シクロアルキル)-C₂-C₈-アルケニル;置換されているか若しくは置換されていない(C₃-C₇-シクロアルキル)-C₂-C₈-アルキニル;置換されているか若しくは置換されていないトリ(C₁-C₈)アルキルシリル;置換されているか若しくは置換されていないトリ(C₁-C₈)アルキルシリル-C₁-C₈-アルキル;置換されているか若しくは置換されていないC₁-C₈-アルキルカルボニル;1~5個のハロゲン原子を有しているC₁-C₈-ハロゲノアルキルカルボニル;置換されているか若しくは置換されていないC₁-C₈-アルキルカルボニルオキシ;1~5個のハロゲン原子を有しているC₁-C₈-ハロゲノアルキルカルボニルオキシ;置換されているか若しくは置換されていないC₁-C₈-アルキルカルボニルアミノ;1~5個のハロゲン原子を有しているC₁-C₈-ハロゲノアルキル-カルボニルアミノ;置換されているか若しくは置換されていないC₁-C₈-アルコキシカルボニル;1~5個のハロゲン原子を有しているC₁-C₈-ハロゲノアルコキシカルボニル;置換されているか若しくは置換されていないC₁-C₈-アルキルオキシカルボニルオキシ;1~5個のハロゲン原子を有しているC₁-C₈-ハロゲノアルコキシカルボニルオキシ;置換されているか若しくは置換されていないC₁-C₈-アルキルカルバモイル;置換されているか若しくは置換されていないジ-C₁-C₈-アルキルカルバモイル;置換されているか若しくは置換されていないC₁-C₈-アルキルアミノカルボニルオキシ;置換されているか若しくは置換されていないジ-C₁-C₈-

10

20

30

40

50

アルキルアミノカルボニルオキシ；置換されているか若しくは置換されていないN - (C₁ - C₈ - アルキル)ヒドロキシカルバモイル；置換されているか若しくは置換されていないC₁ - C₈ - アルコキシカルバモイル；置換されているか若しくは置換されていないN - (C₁ - C₈ - アルキル) - C₁ - C₈ - アルコキシカルバモイル；同一であるか若しくは異なっていることが可能な6以下の基Qで置換され得るアリール；同一であるか若しくは異なっていることが可能な6以下の基Qで置換され得るC₁ - C₈ - アリールアルキル；同一であるか若しくは異なっていることが可能な6以下の基Qで置換され得るC₂ - C₈ - アリールアルケニル；同一であるか若しくは異なっていることが可能な6以下の基Qで置換され得るC₂ - C₈ - アリールアルキニル；同一であるか若しくは異なっていることが可能な6以下の基Qで置換され得るアリールオキシ；同一であるか若しくは異なっていることが可能な6以下の基Qで置換され得るアリールスルファニル；同一であるか若しくは異なっていることが可能な6以下の基Qで置換され得るアリールアミノ；同一であるか若しくは異なっていることが可能な6以下の基Qで置換され得るC₁ - C₈ - アリールアルキルオキシ；同一であるか若しくは異なっていることが可能な6以下の基Qで置換され得るC₁ - C₈ - アリールアルキルスルファニル；又は、同一であるか若しくは異なっていることが可能な6以下の基Qで置換され得るC₁ - C₈ - アリールアルキルアミノを表し；又は

10

・ 2つの置換基Xは、それらが結合している連続した炭素原子と一緒に、同一であるか若しくは異なっていることが可能な4以下の基Qで置換され得る5員又は6員の飽和炭素環を形成することが可能であり；又は、

20

・ Z³とB基への結合点に隣接している置換基Xは、それらが結合している連続した炭素原子と一緒に、置換されているか又は置換されていない5員、6員又は7員の部分的飽和の炭素環又はヘテロ環（ここで、該ヘテロ環は、3個以下のヘテロ原子を含んでいる）を形成し、及び、Z²は、上記に記載されているとおりであり；

・ Qは、独立して、ハロゲン原子；シアノ；ニトロ；置換されているか若しくは置換されていないC₁ - C₈ - アルキル；同一であるか若しくは異なっていることが可能な1～9個のハロゲン原子を有しているC₁ - C₈ - ハロゲノアルキル；置換されているか若しくは置換されていないC₁ - C₈ - アルコキシ；同一であるか若しくは異なっていることが可能な1～9個のハロゲン原子を有しているC₁ - C₈ - ハロゲノアルコキシ；置換されているか若しくは置換されていないC₁ - C₈ - アルキルスルファニル；同一であるか若しくは異なっていることが可能な1～9個のハロゲン原子を有しているC₁ - C₈ - ハロゲノアルキルスルファニル；置換されているか若しくは置換されていないトリ(C₁ - C₈)アルキルシリル；置換されているか若しくは置換されていないトリ(C₁ - C₈)アルキルシリル - C₁ - C₈ - アルキル；置換されているか若しくは置換されていない(C₁ - C₈ - アルコキシイミノ) - C₁ - C₈ - アルキル；置換されているか若しくは置換されていない(ベンジルオキシイミノ) - C₁ - C₈ - アルキルを表す]で表される化合物、並びに、その塩、N - オキシド、金属錯体、半金属錯体及び光学活性異性体又は幾何異性体。

30

【請求項2】

Z¹が、置換されていないシクロプロピル、水素原子、メチル又はエチルを表す、請求項1に記載の化合物。

40

【請求項3】

TがOを表す、請求項1又は請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

X¹がフッ素原子を表す、請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項5】

X²がフッ素原子を表す、請求項1～4のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項6】

Z²及びZ³が、独立して、水素原子又はメチルを表す、請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物。

50

【請求項 7】

Z² が水素原子を表し、且つ、Z³ が水素原子又はメチルを表す、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 8】

B が、置換されているか若しくは置換されていないチエニル環；置換されているか若しくは置換されていないベンゾチエニル環；置換されているか若しくは置換されていないキノリニル環；置換されているか若しくは置換されていないイソキノリニル環；又は、置換されているか若しくは置換されていないベンゾフラン環を表す、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 9】

B が、置換されているか若しくは置換されていないチエニル環を表す、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 10】

B が、置換されているか若しくは置換されていないベンゾチエニル環を表す、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 11】

X が、独立して、ハロゲン原子；置換されているか若しくは置換されていない C₁ - C₈ - アルキル；同一であるか若しくは異なっていることが可能な 9 個以下のハロゲン原子を含んでいる C₁ - C₈ - ハロゲノアルキル；置換されているか若しくは置換されていない C₁ - C₈ - アルコキシ；又は、同一であるか若しくは異なっていることが可能な 9 個以下のハロゲン原子を含んでいる C₁ - C₈ - ハロゲノアルコキシを表す、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 12】

活性成分としての有効量の請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の式 (I) で表される化合物及び農業上許容される支持体、担体又は増量剤を含んでいる、殺菌剤組成物。

【請求項 13】

作物の植物病原性菌類を防除する方法であって、栽培学的に有効で且つ植物に対して実質的に毒性を示さない量の請求項 1 ~ 11 に記載の化合物又は請求項 12 に記載の殺菌剤組成物を、植物がそこで生育しているか若しくは生育することが可能な土壌、植物の葉及び/若しくは果実、又は、植物の種子に施用することを特徴とする、前記方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

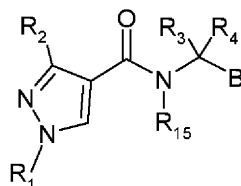
本発明は、N - ヘタリールメチルピラゾリルカルボキサミド誘導体又はそれらのチオカルボキサミド誘導体、それらを調製する方法、殺菌剤としてのそれらの使用、特に、組成物の形態における殺菌剤としてのそれらの使用、並びに、それら化合物又は組成物を使用して植物病原性菌類（特に、植物の植物病原性菌類）を防除する方法に関する。

【0002】

国際特許出願 WO - 2009 / 024342 においては、特定の殺菌性ピラゾール - 4 - カルボン酸アミド類が、下記式：

【0003】

【化 1】



〔式中、R₁ は、アルキル基を表すことができ、R₂ は、ハロゲノアルキル基を表すことができ、R₁₅ は、水素原子又はシクロプロピル基を表すことができ、R₃ 又は R₄ は、

10

20

30

40

50

さまざまな置換基（とりわけ、アルキル基、ハロゲノアルキル基など）を表すことができ、及び、Bは、1～3個のヘテロ原子を含んでいる5～10員の単環式又は縮合したヘテロ芳香族環系を表すことができる]

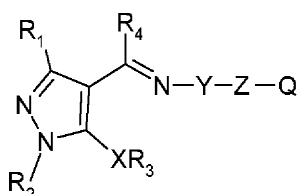
で表される多くの化合物についての広範な開示の中に包括的に含まれている。しかしながら、この文献には、ピラゾリル基の5位の置換基がハロゲン原子を表すことができるそのような誘導体に関しては、開示も示唆もなされていない。さらに、この文献には、カルボキサミド残基の窒素原子に結合したアルキル基、アルコキシ基又はC₄-C₇-シクロアルキル基を含んでいる化合物に関しても、開示も示唆もなされていない。

【0004】

特許出願CN1188764においては、特定の殺菌性ピラゾール誘導体が、下記式：

【0005】

【化2】



〔式中、R₁又はR₂は、アルキル基又はハロゲノアルキル基を表すことができ、Xは、直接結合を表すことができ、R₃は、さまざまな置換基（とりわけ、塩素原子）を表すことができ、R₄は、さまざまな置換基（とりわけ、酸素原子又は硫黄原子）を表すことができ、Y及びZは、直接結合を表すことができ、並びに、Qは、さまざまな基（とりわけ、置換されているベンジル基）を表すことができる]

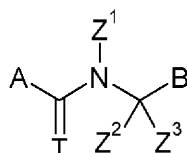
で表される多くの化合物についての広範な開示の中に包括的に含まれている。しかしながら、この文献には、カルボキサミド残基の窒素原子に結合したアルキル基、アルコキシ基又はシクロアルキル基を含んでいる化合物に関しては、開示も示唆もなされていない。さらに、この文献には、ピラゾリル基が1-メチル-3-(ジフルオロ、又は、ジクロロ)メチル-5-(クロロ、又は、フルオロ)-4-ピラゾリル基を表すことができるそのような誘導体を選択することに関しては、明白な開示も示唆もなされていない。

【0006】

国際特許出願WO-2008/015189、国際特許出願WO-2008/037789、国際特許出願WO-2009/016221及び国際特許出願WO-2009/016222においては、特定のアミド誘導体が、下記式：

【0007】

【化3】



〔式中、Aは、炭素で結合した部分的飽和又は不飽和の置換されることが可能な5員ヘテロシクリル基を表すことができ、Zは、置換されている（置換されていない）シクロアルキル基を表すことができ、並びに、Bは、単環式又は縮合した5員及び6員のさまざまなヘテロ芳香族環を表すことができる]

で表される多くの化合物についての広範な開示の中に包括的に含まれている。しかしながら、この文献には、カルボキサミド残基の窒素原子に結合した水素原子、アルキル基又はアルコキシ基を有している化合物に関しては、開示も示唆もなされていない。さらに、これらの文献には、Aが1-メチル-3-(ジフルオロ、又は、ジクロロ)メチル-5-(クロロ、又は、フルオロ)-4-ピラゾリル基を表すことができるそのような誘導体を選択することに関しても、明白な開示も示唆もなされていない。

10

20

30

40

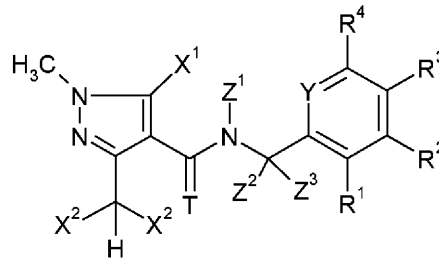
50

【 0 0 0 8 】

国際特許出願 WO - 2 0 1 0 / 1 3 0 7 6 7 においては、特定のアミド誘導体が、下記式：

【 0 0 0 9 】

【 化 4 】



10

〔式中、 X^1 及び X^2 は、塩素原子又はフッ素原子を表すことができ、 T は、 O 又は S を表すことができ、 Z^1 は、置換されている（置換されていない）シクロプロピル基を表すことができ、 Z^2 及び Z^3 は、水素、アルキル基などを表すことができ、 Y は、 N 又は CH であることができ、 $R^1 \sim R^5$ は、さまざまな置換基を表すことができ、並びに、隣接した2つの置換基 R は、それらが結合している連続した炭素原子と一緒に、3個以下のヘテロ原子を含んでいる置換されている（置換されていない）5員又は6員の飽和炭素環又はヘテロ環を形成することができる〕

20

で表される多くの化合物についての広範な開示の中に包括的に含まれている。しかしながら、この文献には、カルボキサミド残基の窒素原子に結合した水素原子、アルキル基又はアルコキシ基を有している化合物に関しては、開示も示唆もなされていない。さらに、この文献には、フェニル環又は2-ピリジル環が単環式又は縮合二環式の別の不飽和ヘテロ芳香族環で置き換えられ得るそのような誘導体を選択することに関しても、明白な開示も示唆もなされていない。

【 先行技術文献 】

【 特許文献 】

【 0 0 1 0 】

【 特許文献 1 】 国際特許出願公開第 2 0 0 9 / 0 2 4 3 4 2 号

30

【 特許文献 2 】 中国特許出願公開第 1 1 8 8 7 6 4 号

【 特許文献 3 】 国際特許出願公開第 2 0 0 8 / 0 1 5 1 8 9 号

【 特許文献 4 】 国際特許出願公開第 2 0 0 8 / 0 3 7 7 8 9 号

【 特許文献 5 】 国際特許出願公開第 2 0 0 9 / 0 1 6 2 2 1 号

【 特許文献 6 】 国際特許出願公開第 2 0 0 9 / 0 1 6 2 2 2 号

【 特許文献 7 】 国際特許出願公開第 2 0 1 0 / 1 3 0 7 6 7 号

【 発明の概要 】

【 発明が解決しようとする課題 】

【 0 0 1 1 】

農業においては、活性成分に対する抵抗性株の発達を回避するか又は制御するために、新規殺有害生物剤化合物を使用することに関して、常に高い関心が持たれている。さらに、既に知られている化合物と少なくとも同等の効力を維持しながら、同時に、使用する活性化合物の量を低減することを目的として、既に知られている化合物よりも活性が高い新規化合物を使用することに関しても、高い関心が持たれている。

40

【 課題を解決するための手段 】

【 0 0 1 2 】

本発明者らは、上記で記載した効果又は有利な点を有している化合物の新規ファミリーを見いだした。

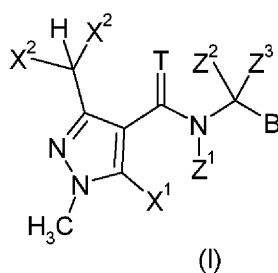
【 0 0 1 3 】

従って、本発明は、式 (I)

50

【 0 0 1 4 】

【 化 5 】



10

〔 式中、

・ T は、O 又は S を表し；
 ・ X^1 及び X^2 (ここで、 X^1 及び X^2 は、同一であるか又は異なっていることが可能である) は、塩素原子又はフッ素原子を表し；

・ Z^1 は、水素原子、置換されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_8$ - アルキル；置換されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_8$ - アルコキシ；置換されているか若しくは置換されていない $C_2 - C_8$ - アルケニル；置換されているか若しくは置換されていない $C_2 - C_8$ - アルキニル；置換されているか若しくは置換されていない $C_3 - C_7$ - シクロアルキル；置換されているか若しくは置換されていない $C_3 - C_7$ - シクロアルキル - $C_1 - C_8$ - アルキル；置換されているか若しくは置換されていない 3 - オキサニル；又は、置換されているか若しくは置換されていない 3 - テタニルを表し；

20

・ Z^2 及び Z^3 (ここで、 Z^2 及び Z^3 は、同一であるか又は異なっていることが可能である) は、水素原子；置換されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_8$ - アルキル；置換されているか若しくは置換されていない $C_2 - C_8$ - アルケニル；置換されているか若しくは置換されていない $C_2 - C_8$ - アルキニル；シアノ；イソニトリル；ニトロ；ハロゲン原子；置換されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_8$ - アルコキシ；置換されているか若しくは置換されていない $C_2 - C_8$ - アルケニルオキシ；置換されているか若しくは置換されていない $C_2 - C_8$ - アルキニルオキシ；置換されているか若しくは置換されていない $C_3 - C_7$ - シクロアルキル；置換されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_8$ - アルキルスルファニル；置換されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_8$ - アルキルスルホニル；置換されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_8$ - アルキルスルフィニル；アミノ；置換されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_8$ - アルキルアミノ；置換されているか若しくは置換されていないジ - $C_1 - C_8$ - アルキルアミノ；置換されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_8$ - アルコキシカルボニル；置換されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_8$ - アルキルカルバモイル；置換されているか若しくは置換されていないジ - $C_1 - C_8$ - アルキルカルバモイル；又は、置換されているか若しくは置換されていない N - $C_1 - C_8$ - アルキル - $C_1 - C_8$ - アルコキシ - カルバモイルを表し；又は、

30

・ Z^2 と Z^3 は、それらが結合している炭素原子と一緒に、置換されているか又は置換されていない $C_3 - C_7$ - シクロアルキルを形成し；又は、

40

・ Z^3 と B 基への結合点に隣接している置換基 X は、それらが結合している連続した炭素原子と一緒に、置換されているか又は置換されていない 5 員、6 員又は 7 員の部分的飽和の炭素環又はヘテロ環 (ここで、該ヘテロ環は、3 個以下のヘテロ原子を含んでいる) を形成し、及び、 Z^2 は、上記で記載されているとおりであり；

・ B は、同一であるか又は異なっていることが可能な 6 以下の基 X で置換され得る飽和又は部分的飽和又は不飽和の単環式又は縮合二環式の 4 員、5 員、6 員、7 員、8 員、9 員又は 10 員の環 (ここで、該環は、N、O、S からなるリストの中で選択される 1 個から 4 個までのヘテロ原子を含んでいる) を表し [但し、B は、2 - ピリジル環ではなく、また、B は、 Z^1 が置換されているか又は置換されていないシクロプロピル基を表す場

50

合には、1, 3 - ベンゾジオキソリル環ではない] ;

・ Xは、ハロゲン原子；ニトロ；シアノ；イソニトリル；ヒドロキシ；アミノ；スルファニル；ペンタフルオロ - ⁶ - スルファニル；ホルミル；ホルミルオキシ；ホルミルアミノ；置換されているか若しくは置換されていない（ヒドロキシイミノ） - C₁ - C₈ - アルキル；置換されているか若しくは置換されていない（C₁ - C₈ - アルコキシイミノ） - C₁ - C₈ - アルキル；置換されているか若しくは置換されていない（C₂ - C₈ - アルケニルオキシイミノ） - C₁ - C₈ - アルキル；置換されているか若しくは置換されていない（C₂ - C₈ - アルキニルオキシイミノ） - C₁ - C₈ - アルキル；置換されているか若しくは置換されていない（ベンジルオキシイミノ） - C₁ - C₈ - アルキル；カルボキシ；カルバモイル；N - ヒドロキシカルバモイル；カルバメート；置換されているか若しくは置換されていない C₁ - C₈ - アルキル；1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₁ - C₈ - ハロゲノアルキル；置換されているか若しくは置換されていない C₂ - C₈ - アルケニル；1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₂ - C₈ - ハロゲノアルケニル；置換されているか若しくは置換されていない C₂ - C₈ - アルキニル；1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₂ - C₈ - ハロゲノアルキニル；置換されているか若しくは置換されていない C₁ - C₈ - アルコキシ；1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₁ - C₈ - ハロゲノアルコキシ；置換されているか若しくは置換されていない C₁ - C₈ - アルキルスルファニル；1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₁ - C₈ - ハロゲノアルキルスルファニル；置換されているか若しくは置換されていない C₁ - C₈ - アルキルスルフィニル；1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₁ - C₈ - ハロゲノアルキルスルフィニル；置換されているか若しくは置換されていない C₁ - C₈ - アルキルスルホニル；1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₁ - C₈ - ハロゲノアルキルスルホニル；置換されているか若しくは置換されていない C₁ - C₈ - アルキルアミノ；置換されているか若しくは置換されていないジ - C₁ - C₈ - アルキルアミノ；置換されているか若しくは置換されていない C₂ - C₈ - アルケニルオキシ；1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₂ - C₈ - ハロゲノアルケニルオキシ；置換されているか若しくは置換されていない C₃ - C₈ - アルキニルオキシ；1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₂ - C₈ - ハロゲノアルキニルオキシ；置換されているか若しくは置換されていない C₃ - C₇ - シクロアルキル；1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₃ - C₇ - ハロゲノシクロアルキル；置換されているか若しくは置換されていない（C₃ - C₇ - シクロアルキル） - C₁ - C₈ - アルキル；置換されているか若しくは置換されていない（C₃ - C₇ - シクロアルキル） - C₂ - C₈ - アルケニル；置換されているか若しくは置換されていない（C₃ - C₇ - シクロアルキル） - C₂ - C₈ - アルキニル；置換されているか若しくは置換されていないトリ（C₁ - C₈）アルキルシリル；置換されているか若しくは置換されていないトリ（C₁ - C₈）アルキルシリル - C₁ - C₈ - アルキル；置換されているか若しくは置換されていない C₁ - C₈ - アルキルカルボニル；1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₁ - C₈ - ハロゲノアルキルカルボニル；置換されているか若しくは置換されていない C₁ - C₈ - アルキルカルボニルオキシ；1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₁ - C₈ - ハロゲノアルキルカルボニルオキシ；置換されているか若しくは置換されていない C₁ - C₈ - アルキルカルボニルアミノ；1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₁ - C₈ - ハロゲノアルキル - カルボニルアミノ；置換されているか若しくは置換されていない C₁ - C₈ - アルコキシカルボニル；1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₁ - C₈ - ハロゲノアルコキシカルボニル；置換されているか若しくは置換されていない C₁ - C₈ - アルキルオキシカルボニルオキシ；1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₁ - C₈ - ハロゲノアルコキシカルボニルオキシ；置換されているか若しくは置換されていない C₁ - C₈ - アルキルカルバモイル；置換されているか若しくは置換されていないジ - C₁ - C₈ - アルキルカルバモイル；置換されているか若しくは置換されていない C₁ - C₈ - アルキルアミノカルボニルオキシ；置換されているか若しくは置換されていないジ - C₁ - C₈ - アルキルアミノカルボニルオキシ；置換されているか若しくは置換されていない N - （C₁ - C₈ - アルキル）ヒドロキシカルバモイル；置換されているか若しくは置換されてい

ない $C_1 - C_8$ - アルコシカルバモイル；置換されているか若しくは置換されていない
 $N - (C_1 - C_8 - \text{アルキル}) - C_1 - C_8$ - アルコシカルバモイル；同一であるか若
 しくは異なっていることが可能な6以下の基Qで置換され得るアリール；同一であるか若
 しくは異なっていることが可能な6以下の基Qで置換され得る $C_1 - C_8$ - アリアルル
 キル；同一であるか若しくは異なっていることが可能な6以下の基Qで置換され得る C_2
 - C_8 - アリアルルケニル；同一であるか若しくは異なっていることが可能な6以下の
 基Qで置換され得る $C_2 - C_8$ - アリアルルキニル；同一であるか若しくは異なっている
 ことが可能な6以下の基Qで置換され得るアリーロキシ；同一であるか若しくは異な
 っていることが可能な6以下の基Qで置換され得るアリールスルファニル；同一であるか
 若しくは異なっていることが可能な6以下の基Qで置換され得るアリールアミノ；同一で
 あるか若しくは異なっていることが可能な6以下の基Qで置換され得る $C_1 - C_8$ - アリ
 ールアルキルオキシ；同一であるか若しくは異なっていることが可能な6以下の基Qで置
 換され得る $C_1 - C_8$ - アリアルルキルスルファニル；又は、同一であるか若しくは異
 なっていることが可能な6以下の基Qで置換され得る $C_1 - C_8$ - アリアルルキルアミ
 ノを表し；又は

10

・ 2つの置換基Xは、それらが結合している連続した炭素原子と一緒に、同一である
 か若しくは異なっていることが可能な4以下の基Qで置換され得る5員又は6員の飽和炭
 素環を形成することが可能であり；又は、

・ Z^3 とB基への結合点に隣接している置換基Xは、それらが結合している連続した
 炭素原子と一緒に、置換されているか又は置換されていない5員、6員又は7員の部分的
 飽和の炭素環又はヘテロ環（ここで、該ヘテロ環は、3個以下のヘテロ原子を含んでいる
 ）を形成し、及び、 Z^2 は、上記で記載されているとおりであり；

20

・ Qは、独立して、ハロゲン原子；シアノ；ニトロ；置換されているか若しくは置換
 されていない $C_1 - C_8$ - アルキル；同一であるか若しくは異なっていることが可能な1
 ~ 9個のハロゲン原子を有している $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルキル；置換されているか若
 しくは置換されていない $C_1 - C_8$ - アルコキシ；同一であるか若しくは異なっている
 ことが可能な1~9個のハロゲン原子を有している $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルコキシ；置換
 されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_8$ - アルキルスルファニル；同一である
 か若しくは異なっていることが可能な1~9個のハロゲン原子を有している $C_1 - C_8$ -
 ハロゲノアルキルスルファニル；置換されているか若しくは置換されていないトリ (C_1
 - C_8) アルキルシリル；置換されているか若しくは置換されていないトリ (C_1 - C_8
) アルキルシリル - $C_1 - C_8$ - アルキル；置換されているか若しくは置換されていない
 ($C_1 - C_8$ - アルコシイミノ) - $C_1 - C_8$ - アルキル；置換されているか若しくは
 置換されていない (ベンジルオキシイミノ) - $C_1 - C_8$ - アルキルを表す]

30

で表される誘導体、並びに、その塩、N-オキシド、金属錯体、半金属錯体及び光学活性
 異性体又は幾何異性体を提供する。

【発明を実施するための形態】

【0015】

特に別途示されていない限り、本発明に従って置換される基又は置換基は、以下の基又
 は原子のうちの一つ以上で置換され得る： ハロゲン原子；ニトロ；ヒドロキシル；シア
 ノ；イソニトリル；アミノ；チオ；ペンタフルオロ - ⁶ - スルファニル基；ホルミル；
 ホルミルオキシ；ホルミルアミノ；カルバモイル；N-ヒドロキシカルバモイル；カルバ
 メート；(ヒドロキシイミノ) - $C_1 - C_6$ - アルキル； $C_1 - C_8$ - アルキル；トリ (C_1
 - C_8 - アルキル) シリル； $C_3 - C_8$ - シクロアルキル；1~5個のハロゲン原子
 を有している $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルキル；1~5個のハロゲン原子を有している C_3
 - C_8 - ハロゲノシクロアルキル； $C_2 - C_8$ - アルケニル； $C_2 - C_8$ - アルキニル；
 $C_2 - C_8$ - アルケニルオキシ； $C_2 - C_8$ - アルキニルオキシ； $C_1 - C_8$ - アルキル
 アミノ；ジ - $C_1 - C_8$ - アルキルアミノ； $C_1 - C_8$ - アルコキシ；1~5個のハロゲ
 ン原子を有している $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルコキシ； $C_1 - C_8$ - アルキルスルファニ
 ル；1~5個のハロゲン原子を有している $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルキルスルファニル；

40

50

C₂ - C₈ - アルケニルオキシ ; 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₂ - C₈ - ハロゲノアルケニルオキシ ; C₃ - C₈ - アルキニルオキシ ; 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₃ - C₈ - ハロゲノアルキニルオキシ ; C₁ - C₈ - アルキルカルボニル ; 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₁ - C₈ - ハロゲノアルキルカルボニル ; C₁ - C₈ - アルキルカルバモイル ; ジ - C₁ - C₈ - アルキルカルバモイル ; N - C₁ - C₈ - アルキルオキシカルバモイル ; C₁ - C₈ - アルコキシカルバモイル ; N - C₁ - C₈ - アルキル - C₁ - C₈ - アルコキシカルバモイル ; C₁ - C₈ - アルコキシカルボニル ; 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₁ - C₈ - ハロゲノアルコキシカルボニル ; C₁ - C₈ - アルキルカルボニルオキシ ; 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₁ - C₈ - ハロゲノアルキルカルボニルオキシ ; C₁ - C₈ - アルキルカルボニルアミノ ; 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₁ - C₈ - ハロゲノアルキルカルボニルアミノ ; C₁ - C₈ - アルキルアミノカルボニルオキシ ; ジ - C₁ - C₈ - アルキルアミノカルボニルオキシ ; C₁ - C₈ - アルキルオキシカルボニルオキシ ; C₁ - C₈ - アルキルスルファニル ; 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₁ - C₈ - ハロゲノアルキルスルファニル ; C₁ - C₈ - アルキルスルフィニル ; 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₁ - C₈ - ハロゲノアルキルスルフィニル ; C₁ - C₈ - アルキルスルホニル ; 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₁ - C₈ - ハロゲノアルキルスルホニル ; C₁ - C₈ - アルキルアミノスルファモイル ; ジ - C₁ - C₈ - アルキルアミノスルファモイル ; (C₁ - C₆ - アルコキシイミノ) - C₁ - C₆ - アルキル ; (C₁ - C₆ - アルケニルオキシイミノ) - C₁ - C₆ - アルキル ; (C₁ - C₆ - アルキニルオキシイミノ) - C₁ - C₆ - アルキル ; 2 - オキソピロリジン - 1 - イル ; (ベンジルオキシイミノ) - C₁ - C₆ - アルキル ; C₁ - C₈ - アルコキシアルキル ; 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有している C₁ - C₈ - ハロゲノアルコキシアルキル ; ベンジルオキシ ; ベンジルスルファニル ; ベンジルアミノ ; アリールオキシ ; アリールスルファニル、又は、アリールアミノ。

【0016】

本発明による化合物は、いずれも、その化合物内の立体単位 (s t e r e o g e n i c u n i t) (I U P A C 規則による定義のとおり) の数に応じて、1 種類以上の立体異性体として存在し得る。かくして、本発明は、等しく、全ての立体異性体及び可能な全ての立体異性体の全ての比率における混合物に関する。当業者は、自体公知の方法により、立体異性体を分離させることができる。

【0017】

本発明によれば、下記総称は、一般に、以下の意味で用いられる：

- ・ ハロゲンは、フッ素、臭素、塩素又はヨウ素を意味する。

【0018】

- ・ ヘテロ原子は、窒素、酸素又は硫黄であることができる；
- ・ アルキル基、アルケニル基又はアルキニル基は、直鎖又は分枝鎖であることができる；
- ・ 用語「アリール」は、置換されていてもよいフェニル又はナフチルを意味する；
- ・ 同一であるか又は異なっていることが可能な2つの置換基で置換されているアミノ基又は別の任意のアミノ含有基のアミノ部分の場合、その2つの置換基は、それらが結合している窒素原子と一緒に、ヘテロシクリル基、好ましくは、5 ~ 7 員のヘテロシクリル基 (ここで、該ヘテロシクリル基は、置換されることが可能であり、又は、別のヘテロ原子を含んでいることが可能である)、例えば、モルホリノ基又はピペリジニル基などを形成することができる。

【0019】

本発明による式 (I) で表される好ましい化合物は、式中の Z¹ が置換されていないシクロプロピルを表す、式 (I) の化合物である。

【0020】

本発明による式 (I) で表される好ましい別の化合物は、式中の Z¹ が水素原子を表す、式 (I) の化合物である。

10

20

30

40

50

【0021】

本発明による式(I)で表される好ましい別の化合物は、式中の Z^1 がメチル又はエチルを表す、式(I)の化合物である。

【0022】

本発明による式(I)で表される好ましい別の化合物は、式中のTがOを表す、式(I)の化合物である。

【0023】

本発明による式(I)で表される好ましい別の化合物は、式中の X^1 がフッ素原子を表す、式(I)の化合物である。

【0024】

本発明による式(I)で表される好ましい別の化合物は、式中の X^2 がフッ素原子を表す、式(I)の化合物である。

【0025】

本発明による式(I)で表される好ましい別の化合物は、式中の Z^2 及び Z^3 が独立して水素原子又はメチルを表す、式(I)の化合物である。

【0026】

本発明による式(I)で表されるさらに好ましい化合物は、式中の Z^2 が水素原子を表し且つ Z^3 が水素原子又はメチルを表す、式(I)の化合物である。

【0027】

本発明による好ましい別の化合物は、式中のBが、置換されているか若しくは置換されていないチエニル環；置換されているか若しくは置換されていないベンゾチエニル環；置換されているか若しくは置換されていないキノリニル環；置換されているか若しくは置換されていないイソキノリニル環；又は、置換されているか若しくは置換されていないベンゾフラン環を表す、式(I)の化合物である。

【0028】

本発明によるさらに好ましい化合物は、式中のBが置換されているか若しくは置換されていないチエニル環を表す、式(I)の化合物である。本発明によるさらに好ましい別の化合物は、式中のBが置換されているか若しくは置換されていないベンゾチエニル環を表す、式(I)の化合物である。

【0029】

本発明による好ましい別の化合物は、式中のXが独立して、ハロゲン原子；置換されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_8$ -アルキル；同一であるか若しくは異なっていることが可能な9個以下のハロゲン原子を含んでいる $C_1 - C_8$ -ハロゲノアルキル；置換されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_8$ -アルコキシ；又は、同一であるか若しくは異なっていることが可能な9個以下のハロゲン原子を含んでいる $C_1 - C_8$ -ハロゲノアルコキシを表す、式(I)の化合物である。

【0030】

本発明による式(I)で表される化合物の置換基に関して上記で挙げた好ましい態様は、個別的に又は部分的に又は全体的に、さまざまに組み合わせることができる。好ましい態様についてのそれらの組合せは、かくして、本発明による化合物のサブクラスを提供する。本発明による好ましい化合物のそのようなサブクラスの例では、以下のものを組み合わせることができる：

- Tの好ましい態様と1以上の X^1 、 X^2 、 $Z^1 \sim Z^3$ 、B及びXの好ましい態様；
- X^1 の好ましい態様と1以上のT、 X^2 、 $Z^1 \sim Z^3$ 、B及びXの好ましい態様；
- X^2 の好ましい態様と1以上のT、 X^1 、 $Z^1 \sim Z^3$ 、B及びXの好ましい態様；
- Z^1 の好ましい態様と1以上のT、 X^1 、 X^2 、 Z^2 、 Z^3 、B及びXの好ましい態様；
- Z^2 の好ましい態様と1以上のT、 X^1 、 X^2 、 Z^1 、 Z^3 、B及びXの好ましい態様；
- Z^3 の好ましい態様と1以上のT、 X^1 、 X^2 、 Z^2 、 Z^4 、B及びXの好ましい

10

20

30

40

50

態様；

- Bの好ましい態様と1以上のT、 X^1 、 X^2 、 $Z^1 \sim Z^3$ 及びXの好ましい態様；
- Xの好ましい態様と1以上のT、 X^1 、 X^2 、 $Z^1 \sim Z^3$ 及びBの好ましい態様。

【0031】

本発明による化合物の置換基の好ましい態様についての上記組合せにおいて、当該好ましい態様を、T、 X^1 、 X^2 、 $Z^1 \sim Z^3$ 、B及びXのそれぞれのさらに好ましい態様の中で選択して、本発明による化合物の最も好ましいサブクラスを構成させることもできる。

【0032】

本発明は、さらにまた、式(I)で表される化合物を調製する方法にも関する。

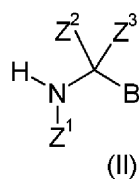
10

【0033】

かくして、本発明のさらなる態様により、本明細書中で定義されている式(I)〔式中、TはOを表す〕で表される化合物を調製するための調製方法P1が提供され、ここで、該調製方法は、式(II)：

【0034】

【化6】

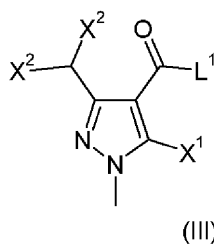


20

〔式中、 Z^1 、 Z^2 、 Z^3 及びBは、本明細書中で定義されているとおりである〕
で表されるN-置換アミン誘導体又はその塩のうちの1種類を、式(III)：

【0035】

【化7】



30

〔式中、 X^1 及び X^2 は、本明細書中で定義されているとおりであり、並びに、 L^1 は、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、 $-OR^a$ 、 $-OC(=O)R^a$ （ここで、 R^a は、置換されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_6$ -アルキル基、置換されているか若しくは置換されていない $C_1 - C_6$ -ハロアルキル基、ベンジル基、4-メトキシベンジル基又はペンタフルオロフェニル基である）からなるリストの中で選択される脱離基を表す〕

で表されるカルボン酸誘導体と、触媒の存在下で、及び、 L^1 がヒドロキシル基を表す場合には縮合剤の存在下で、及び、 L^1 がハロゲン原子を表す場合には酸結合剤の存在下で、反応させることを含む。

40

【0036】

式(II)で表されるN-置換アミン誘導体は、既知であるか、又は、アルデヒド若しくはケトンの還元的アミノ化(Bioorganics and Medicinal Chemistry Letters (2006), 2014)又はイミンの還元(Tetrahedron (2005), 11689)又はハロゲン、メシラート若しくはトシラートの求核置換反応(Journal of Medicinal Chemistry (2002), 3887)などの既知調製方法によって調製することができる。

【0037】

50

式 (I I I) で表されるカルボン酸誘導体は、調製方法 P 2 によって調製することができる。

L¹ がヒドロキシ基を表す場合、本発明による調製方法は縮合剤の存在下で実施する。適切な縮合剤は、以下のものからなる非限定的なリストの中で選択することができる：酸ハロゲン化物形成物質、例えば、ホスゲン、三臭化リン、三塩化リン、五塩化リン、三塩化リン酸化物 (phosphorous trichloride oxide) 若しくは塩化チオニル；無水物形成物質、例えば、クロロギ酸エチル、クロロギ酸メチル、クロロギ酸イソプロピル、クロロギ酸イソブチル若しくはメタンスルホニルクロリド；カルボジイミド類、例えば、N, N' - ジシクロヘキシルカルボジイミド (D C C)、又は、別の慣習的な縮合剤、例えば、五酸化リン、ポリリン酸、N, N' - カルボニル - ジイミダゾール、2 - エトキシ - N - エトキシカルボニル - 1, 2 - ジヒドロキノリン (E E D Q)、トリフェニルホスフィン/テトラクロロ - メタン、4 - (4, 6 - ジメトキシ [1 . 3 . 5] - トリアジン - 2 - イル) - 4 - メチルモルホリニウムクロリド水和物、プロモ - トリピロリジノ - ホスホニウム - ヘキサフルオロホスフェート若しくは無水プロパンホスホン酸 (T 3 P)。

【 0 0 3 8 】

本発明による調製方法は、触媒の存在下で実施する。適切な触媒は、4 - ジメチル - アミノピリジン、1 - ヒドロキシ - ベンゾトリアゾール又はジメチルホルムアミドからなるリストの中で選択することができる。

【 0 0 3 9 】

L¹ がハロゲン原子を表す場合、本発明による調製方法は酸結合剤の存在下で実施する。本発明による調製方法 P 1 を実施するのに適した酸結合剤は、何れの場合にも、そのような反応に関して慣習的な全ての無機塩基及び有機塩基である。好ましくは、以下のものを使用する：アルカリ土類金属、アルカリ金属水素化物、アルカリ金属水酸化物、又は、アルカリ金属アルコキシド、例えば、水酸化ナトリウム、水素化ナトリウム、水酸化カルシウム、水酸化カリウム、カリウム tert - ブトキシド、又は、別の水酸化アンモニウム、アルカリ金属炭酸塩、例えば、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、重炭酸カリウム、重炭酸ナトリウム、アルカリ金属若しくはアルカリ土類金属の酢酸塩、例えば、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、酢酸カルシウム、及び、さらに、第三級アミン、例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、トリブチルアミン、N, N - ジメチルアニリン、ピリジン、N - メチルピペリジン、N, N - ジメチルアミノピリジン、ジアザビシクロオクタン (D A B C O)、ジアザビシクロノネン (D B N) 又はジアザビシクロウンデセン (D B U)。

【 0 0 4 0 】

付加的な縮合剤の非存在下で実施することも可能であるか、又は、過剰量の当該アミン成分を用いてそのアミン成分を同時に酸結合剤として作用させることも可能である。

【 0 0 4 1 】

本発明のさらなる態様により、下記反応スキーム：

調製方法 P 2

【 0 0 4 2 】

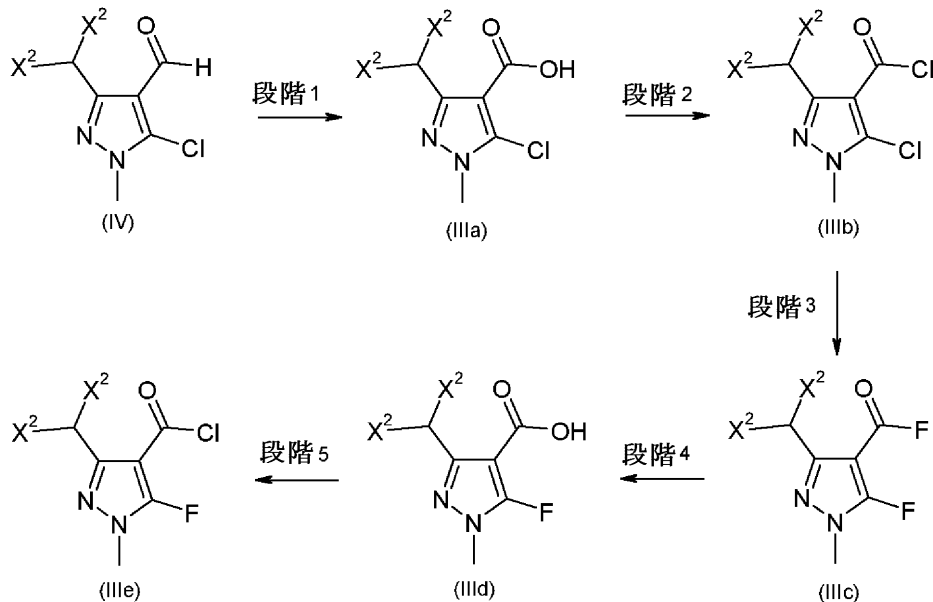
10

20

30

40

【化 8】



10

20

30

40

50

〔ここで、 X^2 は、本明細書中で定義されているとおりである〕
 によって例証されている、式 (III)〔式中、T は O を表す〕で表されるカルボン酸誘導体を調製するための調製方法 P2 が提供される。

【0043】

5 - クロロ - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルバルデヒドは、WO - 2004 / 014138 (参考実施例 35) から既知である。

【0044】

調製方法 P2 の段階 1 は、酸化剤の存在下で、及び、適切な場合には、溶媒の存在下で、実施する。

【0045】

調製方法 P2 の段階 2 及び段階 5 は、酸ハロゲン化物の存在下で、及び、適切な場合には、溶媒の存在下で実施する。

【0046】

調製方法 P2 の段階 3 は、フッ素化剤の存在下で、及び、適切な場合には、溶媒の存在下で実施する。

【0047】

調製方法 P2 の段階 4 は、酸又は塩基の存在下で、及び、適切な場合には、溶媒の存在下で実施する。

【0048】

本発明による調製方法 P2 の段階 1 を実施するのに適している酸化剤は、いずれの場合にも、そのような反応に慣習的な全ての無機酸化剤及び有機酸化剤である。好ましくは、過マンガン酸ベンジルトリエチルアンモニウム、臭素、塩素、m - クロロ過安息香酸、クロム酸、酸化クロム (VI)、過酸化水素、過酸化水素 - 三フッ化ホウ素、過酸化水素 - 尿素、2 - ヒドロキシペルオキシヘキサフルオロ - 2 - プロパノール、ヨウ素、酸素 - 白金触媒、過安息香酸、硝酸ペルオキシアセチル、過マンガン酸カリウム、ルテニウム酸カリウム、ニクロム酸ピリジニウム、酸化ルテニウム (VII)、酸化銀 (I)、酸化銀 (II)、亜硝酸銀、亜塩素酸ナトリウム、次亜塩素酸ナトリウム又は 2, 2, 6, 6 - テトラメチルピペリジン - 1 - オキシルを使用する。

【0049】

本発明による調製方法 P2 の段階 2 及び段階 5 を実施するのに適している酸ハロゲン化物は、いずれの場合にも、そのような反応に慣習的な全ての有機酸ハロゲン化物又は無機酸ハロゲン化物である。好ましくは、特に、ホスゲン、三塩化リン、五塩化リン、三塩化リン酸化物 (phosphorous trichloride oxide)、塩化チ

オニル又は四塩化炭素 - トリフェニルホスフィンを使用する。

【0050】

本発明による調製方法 P 2 の段階 3 を実施するのに適しているフッ素化剤は、いずれの場合にも、そのような反応に慣習的な全てのフッ素化剤である。好ましくは、フッ化セシウム、フッ化カリウム、フッ化カリウム - ニフッ化カルシウム又はテトラブチルアンモニウムフルオリドを使用する。

【0051】

本発明による調製方法 P 2 の段階 1 ~ 段階 5 を実施する場合、その反応温度は、独立して、比較的広い範囲内で変えることができる。一般に、本発明による調製方法は、0 ~ 160 の温度で、好ましくは、10 ~ 120 の温度で、実施する。本発明による調製方法に関して温度を制御する方法では、マイクロ波技術を使用する。

10

【0052】

本発明による調製方法 P 2 の段階 1 ~ 段階 5 は、一般に、独立して、大気圧下で実施する。しかしながら、いずれの場合にも、高圧下又は減圧下で実施することも可能である。

【0053】

本発明による調製方法 P 2 の段階 1 を実施する場合、式 (I V) で表されるアルデヒドの 1 モル当たり、一般に、1 モル又は過剰量の酸化剤を使用する。当該反応成分を別の比率で使用することも可能である。

【0054】

本発明による調製方法 P 2 の段階 2 及び段階 5 を実施する場合、式 (I I I a) 又は式 (I I I d) で表される酸の 1 モル当たり、一般に、1 モル又は過剰量の酸ハロゲン化物を使用する。当該反応成分を別の比率で使用することも可能である。

20

【0055】

本発明による調製方法 P 2 の段階 3 を実施する場合、酸塩化物 (I I I b) の 1 モル当たり、一般に、1 モル又は過剰量のフッ素化剤を使用する。当該反応成分を別の比率で使用することも可能である。

【0056】

本発明による調製方法 P 2 の段階 4 を実施する場合、酸フッ化物 (I I I c) の 1 モル当たり、一般に、1 モル又は過剰量の酸又は塩基を使用する。当該反応成分を別の比率で使用することも可能である。

30

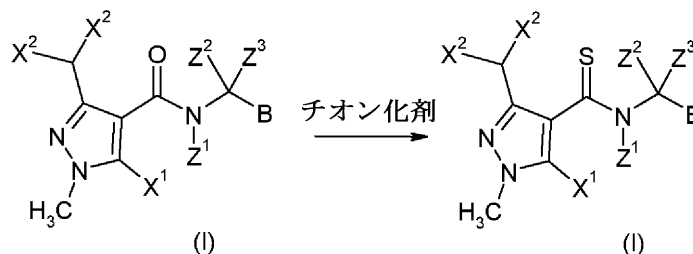
【0057】

本発明のさらなる態様により、下記反応スキーム：

調製方法 P 3

【0058】

【化 9】



40

〔ここで、X¹、X²、Z¹、Z²、Z³ 及び B は、本明細書中で定義されているとおりである〕

によって例証されている、式 (I)〔式中、T は O を表す〕で表される化合物から出発して、場合により触媒量又は化学量論的量 (stoichiometric) 又はそれより多い量の塩基 (例えば、無機塩基及び有機塩基) の存在下で式 (I)〔式中、T は S を表す〕で表される化合物を調製するための調製方法 P 3 が提供される。好ましくは、以下のものを使用する：アルカリ金属炭酸塩、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、重炭酸

50

カリウム、重炭酸ナトリウム；ヘテロ環式芳香族塩基、例えば、ピリジン、ピコリン、ルチジン、コリジン；及び、さらに、第3級アミン、例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジメチルアミノピリジン又はN-メチル-ピペリジン。

【0059】

本発明による調製方法P3は、チオン化剤(thionating agent)の存在下で実施する。

【0060】

式(I)で表される出発アミド誘導体は、調製方法P1に従って調製することができる。

10

【0061】

本発明による調製方法P3を実施するのに適したチオン化剤は、硫黄(S)、メルカプト酸(sulfhydrylic acid)(H_2S)、硫化ナトリウム(Na_2S)、水酸化ナトリウム($NaHS$)、三硫化ホウ素(B_2S_3)、ビス(ジエチルアルミニウム)スルフィド($(AlEt_2)_2S$)、硫化アンモニウム($(NH_4)_2S$)、五硫化リン(phosphorous pentasulfide)(P_2S_5)、ローソン試薬(2,4-ビス(4-メトキシフェニル)-1,2,3,4-ジチアジホスフェタン-2,4-ジスルフィド)又はポリマー担持チオン化試薬(例えば、「Journal of the Chemical Society, Perkin 1 (2001), 358」に記載されているポリマー担持チオン化試薬)であり得る。

20

【0062】

後処理は、慣習的な方法で実施する。一般に、当該反応混合物を水で処理し、その有機相を分離し、脱水後、減圧下に濃縮する。適切な場合には、残った残渣から、依然として存在している可能性のある不純物を、クロマトグラフィー、再結晶又は蒸留などの慣習的な方法によって除去することができる。

【0063】

本発明の化合物は、上記で記載した一般的な調製方法に準じて調製することができる。それにもかかわらず、当業者が、自分の一般的な知識及び利用可能な刊行物に基づいて、合成することが望ましい本発明化合物のそれぞれの特性に応じて該調製方法を適合させることができるということは理解されるであろう。

30

【0064】

さらなる態様において、本発明は、有効で且つ植物に対して毒性を示さない量の式(I)で表される活性化合物を含んでいる殺菌剤組成物にも関する。

【0065】

「有効で且つ植物に対して毒性を示さない量」という表現は、作物上に存在しているか又はおそらく出現するであろう菌類を防除又は駆除するのに充分で、且つ、該作物について植物毒性の感知可能などのような症状も引き起こすことのない、本発明組成物の量を意味する。そのような量は、防除対象の菌類、作物の種類、気候条件、及び、本発明の殺菌剤組成物に含まれている化合物に応じて、広い範囲内で変動し得る。そのような量は、当業者が実行可能な範囲内にある体系的な圃場試験により決定することが可能である。

40

【0066】

かくして、本発明により、活性成分としての有効量の本明細書中で定義されている式(I)で表される化合物及び農業上許容される支持体、担体又は増量剤を含んでいる殺菌剤組成物が提供される。

【0067】

本発明によれば、用語「支持体(support)」は、式(I)の活性化合物と組み合わせる又は関連させて、特に植物の一部に対して、より容易に施用できるようにする、天然又は合成の有機化合物又は無機化合物を意味する。このような支持体は、従って、一般に不活性であり、また、農業上許容されるものであるべきである。支持体は、固体であることができるし、又は、液体であることもできる。適切な支持体の例としては、クレ

50

一、天然又は合成のシリケート、シリカ、樹脂、蠟、固形肥料、水、アルコール（特に、ブタノール）、有機溶媒、鉱油及び植物油、並びに、それらの誘導体などを挙げることができる。このような支持体の混合物を使用することもできる。

【0068】

本発明の組成物には、さらにまた、付加的な成分も含有させることができる。特に、該組成物には、さらに、界面活性剤を含有させることができる。該界面活性剤は、イオン性若しくは非イオン性のタイプの乳化剤、分散剤若しくは湿潤剤であることが可能であるか、又は、そのような界面活性剤の混合物であることが可能である。例えば、以下のものを挙げることができる：ポリアクリル酸塩、リグノスルホン酸塩、フェノールスルホン酸塩若しくはナフタレンスルホン酸塩、エチレンオキシドと脂肪アルコールの重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪酸の重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪アミンの重縮合物、置換されているフェノール（特に、アルキルフェノール又はアリアルフェノール）、スルホコハク酸エステルの塩、タウリン誘導体（特に、アルキルタウレート）、ポリオキシエチル化アルコールのリン酸エステル若しくはポリオキシエチル化フェノールのリン酸エステル、ポリオールの脂肪酸エステル、並びに、硫酸官能基、スルホン酸官能基及びリン酸官能基を含んでいる上記化合物の誘導体。該活性化合物及び/又は該不活性支持体が水不溶性である場合、並びに、施用のための媒介物（vector agent）が水である場合、一般に、少なくとも1種類の界面活性剤を存在させることが必要である。好ましくは、界面活性剤の含有量は、該組成物の5重量%～40重量%であり得る。

10

【0069】

場合により、さらなる成分、例えば、保護コロイド、粘着剤、増粘剤、揺変剤、浸透剤、安定化剤、金属イオン封鎖剤などを含ませることもできる。さらに一般的には、該活性化合物は、通常の製剤技術に従う固体又は液体の任意の添加剤と組み合わせることが可能である。

20

【0070】

一般に、本発明の組成物には、0.05～99重量%の活性化合物、好ましくは、10～70重量%の活性化合物を含有させることができる。

【0071】

本発明の組成物は、エアゾルディスペンサー、カプセル懸濁液剤、冷煙霧濃厚剤（cold fogging concentrate）、散粉性粉剤、乳剤、水中油型エマルジョン剤、油中水型エマルジョン剤、カプセル化粒剤、細粒剤、種子処理用フロアブル剤、ガス剤（加圧下）、ガス生成剤（gas generating product）、粒剤、温煙霧濃厚剤（hot fogging concentrate）、大型粒剤、微粒剤、油分散性粉剤、油混和性フロアブル剤、油混和性液剤、ペースト剤、植物用棒状剤（plant rodlet）、乾燥種子処理用粉剤、農薬粉衣種子、可溶性濃厚剤（soluble concentrate）、可溶性粉剤、種子処理用溶液剤、懸濁製剤（フロアブル剤）、微量散布用液剤（ultra low volume（ULV）liquid）、微量散布用懸濁液剤（ultra low volume（ULV）suspension）、顆粒水和剤、水分散性錠剤、スラリー処理用水和剤、水溶性顆粒剤、水溶性錠剤、種子処理用水溶性粉剤及び水和剤などのような、さまざまな形態で使用することが可能である。これらの組成物には、処理対象の植物又は種子に対して噴霧装置又は散粉装置のような適切な装置を用いて施用される状態にある組成物のみではなく、作物に対して施用する前に希釈することが必要な商業的な濃厚組成物も包含される。

30

40

【0072】

本発明の化合物は、さらにまた、1種類以上の殺虫剤、殺菌剤、殺細菌剤、誘引剤、殺ダニ剤若しくはフェロモン活性物質、又は、生物学的活性を有する別の化合物と混合することもできる。そのようにして得られた混合物は、通常、拡大された活性スペクトルを有する。別の殺菌剤化合物との混合物が特に有利である。

【0073】

適切な混合相手殺菌剤の例は、下記リストの中で選択され得る：

50

(1) エルゴステロール生合成の阻害薬、例えば、(1 . 1) アルジモルフ (1 7 0 4 - 2 8 - 5)、(1 . 2) アザコナゾール (6 0 2 0 7 - 3 1 - 0)、(1 . 3) ビテルタノール (5 5 1 7 9 - 3 1 - 2)、(1 . 4) プロムコナゾール (1 1 6 2 5 5 - 4 8 - 2)、(1 . 5) シプロコナゾール (1 1 3 0 9 6 - 9 9 - 4)、(1 . 6) ジクロブトラゾール (7 5 7 3 6 - 3 3 - 3)、(1 . 7) ジフェノコナゾール (1 1 9 4 4 6 - 6 8 - 3)、(1 . 8) ジニコナゾール (8 3 6 5 7 - 2 4 - 3)、(1 . 9) ジニコナゾール - M (8 3 6 5 7 - 1 8 - 5)、(1 . 1 0) ドデモルフ (1 5 9 3 - 7 7 - 7)、(1 . 1 1) 酢酸ドデモルフ (3 1 7 1 7 - 8 7 - 0)、(1 . 1 2) エポキシコナゾール (1 0 6 3 2 5 - 0 8 - 0)、(1 . 1 3) エタコナゾール (6 0 2 0 7 - 9 3 - 4)、(1 . 1 4) フェナリモール (6 0 1 6 8 - 8 8 - 9)、(1 . 1 5) フェンブコナゾール (1 1 4 3 6 9 - 4 3 - 6)、(1 . 1 6) フェンヘキサミド (1 2 6 8 3 3 - 1 7 - 8)、(1 . 1 7) フェンプロピジン (6 7 3 0 6 - 0 0 - 7)、(1 . 1 8) フェンプロピモルフ (6 7 3 0 6 - 0 3 - 0)、(1 . 1 9) フルキンコナゾール (1 3 6 4 2 6 - 5 4 - 5)、(1 . 2 0) フルルプリミドール (5 6 4 2 5 - 9 1 - 3)、(1 . 2 1) フルシラゾール (8 5 5 0 9 - 1 9 - 9)、(1 . 2 2) フルトリアホール (7 6 6 7 4 - 2 1 - 0)、(1 . 2 3) フルコナゾール (1 1 2 8 3 9 - 3 3 - 5)、(1 . 2 4) フルコナゾール - シス (1 1 2 8 3 9 - 3 2 - 4)、(1 . 2 5) ヘキサコナゾール (7 9 9 8 3 - 7 1 - 4)、(1 . 2 6) イマザリル (6 0 5 3 4 - 8 0 - 7)、(1 . 2 7) 硫酸イマザリル (5 8 5 9 4 - 7 2 - 2)、(1 . 2 8) イミベンコナゾール (8 6 5 9 8 - 9 2 - 7)、(1 . 2 9) イブコナゾール (1 2 5 2 2 5 - 2 8 - 7)、(1 . 3 0) メトコナゾール (1 2 5 1 1 6 - 2 3 - 6)、(1 . 3 1) ミクロブタニル (8 8 6 7 1 - 8 9 - 0)、(1 . 3 2) ナフチフィン (6 5 4 7 2 - 8 8 - 0)、(1 . 3 3) ヌアリモール (6 3 2 8 4 - 7 1 - 9)、(1 . 3 4) オキシポコナゾール (1 7 4 2 1 2 - 1 2 - 5)、(1 . 3 5) パクロブトラゾール (7 6 7 3 8 - 6 2 - 0)、(1 . 3 6) ペフラゾエート (1 0 1 9 0 3 - 3 0 - 4)、(1 . 3 7) ペンコナゾール (6 6 2 4 6 - 8 8 - 6)、(1 . 3 8) ピペラリン (3 4 7 8 - 9 4 - 2)、(1 . 3 9) プロクロラズ (6 7 7 4 7 - 0 9 - 5)、(1 . 4 0) プロピコナゾール (6 0 2 0 7 - 9 0 - 1)、(1 . 4 1) プロチオコナゾール (1 7 8 9 2 8 - 7 0 - 6)、(1 . 4 2) ピリブチカルブ (8 8 6 7 8 - 6 7 - 5)、(1 . 4 3) ピリフェノックス (8 8 2 8 3 - 4 1 - 4)、(1 . 4 4) キンコナゾール (1 0 3 9 7 0 - 7 5 - 8)、(1 . 4 5) シメコナゾール (1 4 9 5 0 8 - 9 0 - 7)、(1 . 4 6) スピロキサミン (1 1 8 1 3 4 - 3 0 - 8)、(1 . 4 7) テブコナゾール (1 0 7 5 3 4 - 9 6 - 3)、(1 . 4 8) テルピナフィン (9 1 1 6 1 - 7 1 - 6)、(1 . 4 9) テトラコナゾール (1 1 2 2 8 1 - 7 7 - 3)、(1 . 5 0) トリアジメホン (4 3 1 2 1 - 4 3 - 3)、(1 . 5 1) トリアジメノール (8 9 4 8 2 - 1 7 - 7)、(1 . 5 2) トリデモルフ (8 1 4 1 2 - 4 3 - 3)、(1 . 5 3) トリフルミゾール (6 8 6 9 4 - 1 1 - 1)、(1 . 5 4) トリホリン (2 6 6 4 4 - 4 6 - 2)、(1 . 5 5) トリチコナゾール (1 3 1 9 8 3 - 7 2 - 7)、(1 . 5 6) ウニコナゾール (8 3 6 5 7 - 2 2 - 1)、(1 . 5 7) ウニコナゾール - p (8 3 6 5 7 - 1 7 - 4)、(1 . 5 8) ビニコナゾール (7 7 1 7 4 - 6 6 - 4)、(1 . 5 9) ポリコナゾール (1 3 7 2 3 4 - 6 2 - 9)、(1 . 6 0) 1 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) シクロヘプタノール (1 2 9 5 8 6 - 3 2 - 9)、(1 . 6 1) 1 - (2 , 2 - ジメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) - 1 H - イミダゾール - 5 - カルボン酸メチル (1 1 0 3 2 3 - 9 5 - 0)、(1 . 6 2) N ' - { 5 - (ジフルオロメチル) - 2 - メチル - 4 - [3 - (トリメチルシリル) プロボキシ] フェニル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1 . 6 3) N - エチル - N - メチル - N ' - { 2 - メチル - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 - [3 - (トリメチルシリル) プロボキシ] フェニル } イミドホルムアミド、及び、(1 . 6 4) O - [1 - (4 - メトキシフェノキシ) - 3 , 3 - ジメチルブタン - 2 - イル] 1 H - イミダゾール - 1 - カルボチオエート (1 1 1 2 2 6 - 7 1 - 2) ;

10

20

30

40

50

(2) 複合体 I 又は I I における呼吸鎖の阻害薬、例えば、(2.1) ピキサフェン (581809-46-3)、(2.2) ボスカリド (188425-85-6)、(2.3) カルボキシシン (5234-68-4)、(2.4) ジフルメトリム (130339-07-0)、(2.5) フェンフラム (24691-80-3)、(2.6) フルオピラム (658066-35-4)、(2.7) フルトラニル (66332-96-5)、(2.8) フルキサピロキサド (907204-31-3)、(2.9) フラメトピル (123572-88-3)、(2.10) フルメシクロックス (60568-05-0)、(2.11) イソピラザム (シン-エピマー性ラセミ化合物 (1RS, 4SR, 9RS) とアンチ-エピマー性ラセミ化合物 (1RS, 4SR, 9SR) の混合物) (881685-58-1)、(2.12) イソピラザム (アンチ-エピマー性ラセミ化合物 1RS, 4SR, 9SR)、(2.13) イソピラザム (アンチ-エピマー性エナンチオマー 1R, 4S, 9S)、(2.14) イソピラザム (アンチ-エピマー性エナンチオマー 1S, 4R, 9R)、(2.15) イソピラザム (シン-エピマー性ラセミ化合物 1RS, 4SR, 9RS)、(2.16) イソピラザム (シン-エピマー性エナンチオマー 1R, 4S, 9R)、(2.17) イソピラザム (シン-エピマー性エナンチオマー 1S, 4R, 9S)、(2.18) メプロニル (55814-41-0)、(2.19) オキシカルボキシシン (5259-88-1)、(2.20) ペンフルフェン (494793-67-8)、(2.21) ペンチオピラド (183675-82-3)、(2.22) セダキサシン (874967-67-6)、(2.23) チフルザミド (130000-40-7)、(2.24) 1-メチル-N-[2-(1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ)フェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.25) 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[2-(1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ)フェニル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.26) 3-(ジフルオロメチル)-N-[4-フルオロ-2-(1,1,2,3,3-ヘキサフルオロプロポキシ)フェニル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.27) N-[1-(2,4-ジクロロフェニル)-1-メトキシプロパン-2-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド (1092400-95-7) (WO 2008148570)、(2.28) 5,8-ジフルオロ-N-[2-(2-フルオロ-4-{[4-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]オキシ}フェニル)エチル]キナゾリン-4-アミン (1210070-84-0) (WO 2010025451)、(2.29) N-[9-(ジクロロメチレン)-1,2,3,4-テトラヒドロ-1,4-メタノナフタレン-5-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.30) N-[(1S,4R)-9-(ジクロロメチレン)-1,2,3,4-テトラヒドロ-1,4-メタノナフタレン-5-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、及び、(2.31) N-[(1R,4S)-9-(ジクロロメチレン)-1,2,3,4-テトラヒドロ-1,4-メタノナフタレン-5-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド；

(3) 複合体 I I I における呼吸鎖の阻害薬、例えば、(3.1) アメトクトラジン (865318-97-4)、(3.2) アミスルプロム (348635-87-0)、(3.3) アゾキシストロピン (131860-33-8)、(3.4) シアゾファミド (120116-88-3)、(3.5) クメトキシストロピン (coumethoxy strobilin) (850881-30-0)、(3.6) クモキシストロピン (coumoxystrobilin) (850881-70-8)、(3.7) ジモキシストロピン (141600-52-4)、(3.8) エネストロプリン (238410-11-2) (WO 2004/058723)、(3.9) ファモキサドン (131807-57-3) (WO 2004/058723)、(3.10) フェンアミドン (161326-34-7) (WO 2004/058723)、(3.11) フェノキシストロピン (fenoxystrobilin) (918162-02-4)、(3.12) フルオキサスト

ロビン(361377-29-9)(WO 2004/058723)、(3.13)クレソキシム-メチル(143390-89-0)(WO 2004/058723)、(3.14)メトミノストロビン(133408-50-1)(WO 2004/058723)、(3.15)オリサストロビン(189892-69-1)(WO 2004/058723)、(3.16)ピコキシストロビン(117428-22-5)(WO 2004/058723)、(3.17)ピラクロストロビン(175013-18-0)(WO 2004/058723)、(3.18)ピラメトストロビン(pyrametostrobilin)(915410-70-7)(WO 2004/058723)、(3.19)ピラオキシストロビン(pyraoxystrobilin)(862588-11-2)(WO 2004/058723)、(3.20)ピリベンカルブ(799247-52-2)(WO 2004/058723)、(3.21)トリクロピリカルブ(triclopyricarb)(902760-40-1)、(3.22)トリフロキシストロビン(141517-21-7)(WO 2004/058723)、(3.23)(2E)-2-(2-{[6-(3-クロロ-2-メチルフェノキシ)-5-フルオロピリミジン-4-イル]オキシ}フェニル)-2-(メトキシイミノ)-N-メチルエタンアミド(WO 2004/058723)、(3.24)(2E)-2-(メトキシイミノ)-N-メチル-2-(2-{[(1E)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチルデン}アミノ]オキシ}メチル}フェニル)エタンアミド(WO 2004/058723)、(3.25)(2E)-2-(メトキシイミノ)-N-メチル-2-{2-[(E)-({1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エトキシ}イミノ)メチル]フェニル}エタンアミド(158169-73-4)、(3.26)(2E)-2-{2-[(E)-({1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチルデン}アミノ)オキシ}メチル]フェニル}-2-(メトキシイミノ)-N-メチルエタンアミド(326896-28-0)、(3.27)(2E)-2-{2-[(E,3E)-4-(2,6-ジクロロフェニル)ブタ-3-エン-2-イリデン]アミノ}オキシ}メチル]フェニル}-2-(メトキシイミノ)-N-メチルエタンアミド、(3.28)2-クロロ-N-(1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)ピリジン-3-カルボキサミド(119899-14-8)、(3.29)5-メトキシ-2-メチル-4-(2-{[(1E)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチルデン}アミノ]オキシ}メチル}フェニル)-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン、(3.30)(2E)-2-{2-[(シクロプロピル[(4-メトキシフェニル)イミノ]メチル}スルファニル)メチル]フェニル}-3-メトキシプロパ-2-エン酸メチル(149601-03-6)、(3.31)N-(3-エチル-3,5,5-トリメチルシクロヘキシル)-3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシベンズアミド(226551-21-9)、(3.32)2-{2-[(2,5-ジメチルフェノキシ)メチル]フェニル}-2-メトキシ-N-メチルアセトアミド(173662-97-0)、及び、(3.33)(2R)-2-{2-[(2,5-ジメチルフェノキシ)メチル]フェニル}-2-メトキシ-N-メチルアセトアミド(394657-24-0)；

(4) 有糸分裂及び細胞分裂の阻害薬、例えば、(4.1)ベノミル(17804-35-2)、(4.2)カルベンダジム(10605-21-7)、(4.3)クロルフエナゾール(3574-96-7)、(4.4)ジエトフェンカルブ(87130-20-9)、(4.5)エタボキサム(162650-77-3)、(4.6)フルオピコリド(239110-15-7)、(4.7)フベリダゾール(3878-19-1)、(4.8)ペンシクロン(66063-05-6)、(4.9)チアベンダゾール(148-79-8)、(4.10)チオファネート-メチル(23564-05-8)、(4.11)チオファネート(23564-06-9)、(4.12)ゾキサミド(156052-68-5)、(4.13)5-クロロ-7-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン(214706-53-3)、及び、(4.14)3-クロロ-5-(6-クロ

ロピリジン - 3 - イル) - 6 - メチル - 4 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) ピリダジン (1002756 - 87 - 7) ;

(5) 多部位に作用し得る化合物、例えば、(5.1) ボルドー液 (8011 - 63 - 0)、(5.2) カプタホール (2425 - 06 - 1)、(5.3) キャプタン (133 - 06 - 2) (WO 02 / 12172)、(5.4) クロロタロニル (1897 - 45 - 6)、(5.5) 水酸化銅 (20427 - 59 - 2)、(5.6) ナフテン酸銅 (1338 - 02 - 9)、(5.7) 酸化銅 (1317 - 39 - 1)、(5.8) 塩基性塩化銅 (1332 - 40 - 7)、(5.9) 硫酸銅 (2+) (7758 - 98 - 7)、(5.10) ジクロフルアニド (1085 - 98 - 9)、(5.11) ジチアノン (3347 - 22 - 6)、(5.12) ドジン (2439 - 10 - 3)、(5.13) ドジン遊離塩基、(5.14) ファーバム (14484 - 64 - 1)、(5.15) フルオロホルペット (719 - 96 - 0)、(5.16) ホルペット (133 - 07 - 3)、(5.17) ゲアザチン (108173 - 90 - 6)、(5.18) 酢酸ゲアザチン、(5.19) イミノクタジン (13516 - 27 - 3)、(5.20) イミノクタジンアルベシル酸塩 (169202 - 06 - 6)、(5.21) イミノクタジン三酢酸塩 (57520 - 17 - 9)、(5.22) マンカップー (53988 - 93 - 5)、(5.23) マンゼブ (8018 - 01 - 7)、(5.24) マンネブ (12427 - 38 - 2)、(5.25) メチラム (9006 - 42 - 2)、(5.26) メチラム亜鉛 (metiram zinc) (9006 - 42 - 2)、(5.27) オキシ銅 (10380 - 28 - 6)、(5.28) プロパミジン (propamidine) (104 - 32 - 5)、(5.29) プロピネブ (12071 - 83 - 9)、(5.30) 硫黄及び硫黄剤、例えば、多硫化カルシウム (7704 - 34 - 9)、(5.31) チウラム (137 - 26 - 8)、(5.32) トリフルアニド (731 - 27 - 1)、(5.33) ジネブ (12122 - 67 - 7)、及び、(5.34) ジラム (137 - 30 - 4) ;

(6) 宿主の防御を誘発し得る化合物、例えば、(6.1) アシベンゾラル - S - メチル (135158 - 54 - 2)、(6.2) イソチアニル (224049 - 04 - 1)、(6.3) プロベナゾール (27605 - 76 - 1)、及び、(6.4) チアジニル (223580 - 51 - 6) ;

(7) アミノ酸及び/又はタンパク質の生合成の阻害薬、例えば、(7.1) アンドプリム (andoprime) (23951 - 85 - 1)、(7.2) プラストサイジン - S (2079 - 00 - 7)、(7.3) シプロジニル (121552 - 61 - 2)、(7.4) カスガマイシン (6980 - 18 - 3)、(7.5) カスガマイシン塩酸塩水和物 (19408 - 46 - 9)、(7.6) メバニピリム (110235 - 47 - 7)、(7.7) ピリメタニル (53112 - 28 - 0)、及び、(7.8) 3 - (5 - フルオロ - 3, 3, 4, 4 - テトラメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル) キノリン (861647 - 32 - 7) (WO 2005070917) ;

(8) ATP 産生の阻害薬、例えば、(8.1) 酢酸トリフェニルスズ (900 - 95 - 8)、(8.2) 塩化トリフェニルスズ (639 - 58 - 7)、(8.3) 水酸化トリフェニルスズ (76 - 87 - 9)、及び、(8.4) シルチオファミン (175217 - 20 - 6) ;

(9) 細胞壁合成の阻害薬、例えば、(9.1) ベンチアバリカルブ (177406 - 68 - 7)、(9.2) ジメトモルフ (110488 - 70 - 5)、(9.3) フルモルフ (211867 - 47 - 9)、(9.4) イプロバリカルブ (140923 - 17 - 7)、(9.5) マンジプロパミド (374726 - 62 - 2)、(9.6) ポリオキシソリン (11113 - 80 - 7)、(9.7) ポリオキシソリム (22976 - 86 - 9)、(9.8) バリダマイシン A (37248 - 47 - 8)、及び、(9.9) バリフェナレート (283159 - 94 - 4 ; 283159 - 90 - 0) ;

(10) 脂質及び膜の合成の阻害薬、例えば、(10.1) ビフェニル (92 - 52 - 4)、(10.2) クロロネブ (2675 - 77 - 6)、(10.3) ジクロラン (99 - 30 - 9)、(10.4) エジフェンホス (17109 - 49 - 8)、(10.5)

10

20

30

40

50

エトリジアゾール(2593-15-9)、(10.6)ヨードカルブ(iodocarb)(55406-53-6)、(10.7)イプロベンホス(26087-47-8)、(10.8)イソプロチオラン(50512-35-1)、(10.9)プロパモカルブ(25606-41-1)、(10.10)プロパモカルブ塩酸塩(25606-41-1)、(10.11)プロチオカルブ(19622-08-3)、(10.12)ピラゾホス(13457-18-6)、(10.13)キントゼン(82-68-8)、(10.14)テクナゼン(117-18-0)、及び、(10.15)トルクロホス-メチル(57018-04-9)；

(11) メラニン合成の阻害薬、例えば、(11.1)カルプロパミド(104030-54-8)、(11.2)ジクロシメット(139920-32-4)、(11.3)フェノキサニル(115852-48-7)、(11.4)フタリド(27355-22-2)、(11.5)ピロキロン(57369-32-1)、(11.6)トリシクラゾール(41814-78-2)、及び、(11.7){3-メチル-1-[(4-メチルベンゾイル)アミノ]ブタン-2-イル}カルバミン酸2,2,2-トリフルオロエチル(851524-22-6)(WO 2005042474)；

(12) 核酸合成の阻害薬、例えば、(12.1)ベナラキシル(71626-11-4)、(12.2)ベナラキシル-M(キララキシル(kiralaxyl))(98243-83-5)、(12.3)プピリメート(41483-43-6)、(12.4)クロジラコン(67932-85-8)、(12.5)ジメチリモール(5221-53-4)、(12.6)エチリモール(23947-60-6)、(12.7)フララキシル(57646-30-7)、(12.8)ヒメキサゾール(10004-44-1)、(12.9)メタラキシル(57837-19-1)、(12.10)メタラキシル-M(メフェノキサム)(70630-17-0)、(12.11)オフラセ(58810-48-3)、(12.12)オキサジキシル(77732-09-3)、及び、(12.13)オキソリン酸(14698-29-4)；

(13) シグナル伝達の阻害薬、例えば、(13.1)クロゾリネート(84332-86-5)、(13.2)フェンピクロニル(74738-17-3)、(13.3)フルジオキソニル(131341-86-1)、(13.4)イプロジオン(36734-19-7)、(13.5)プロシミドン(32809-16-8)、(13.6)キノキシフェン(124495-18-7)、及び、(13.7)ピンクロゾリン(50471-44-8)；

(14) 脱共役剤として作用し得る化合物、例えば、(14.1)ピナパクリル(485-31-4)、(14.2)ジノカップ(131-72-6)、(14.3)フェリムゾン(89269-64-7)、(14.4)フルアジナム(79622-59-6)、及び、(14.5)メプチルジノカップ(131-72-6)；

(15) さらなる化合物、例えば、(15.1)ベンチアゾール(21564-17-0)、(15.2)ベトキサジン(163269-30-5)、(15.3)カプシマイシン(capsimycin)(70694-08-5)、(15.4)カルボン(99-49-0)、(15.5)キノメチオネート(2439-01-2)、(15.6)ピリオフェノン(クラザフェノン(chlazaferone))(688046-61-9)、(15.7)クフラネブ(11096-18-7)、(15.8)シフルフェナム(180409-60-3)、(15.9)シモキサニル(57966-95-7)、(15.10)シプロスルファミド(221667-31-8)、(15.11)ダゾメット(533-74-4)、(15.12)デバカルブ(62732-91-6)、(15.13)ジクロロフェン(97-23-4)、(15.14)ジクロメジン(62865-36-5)、(15.15)ジフェンゾコート(49866-87-7)、(15.16)ジフェンゾコートメチル硫酸塩(43222-48-6)、(15.17)ジフェニルアミン(122-39-4)、(15.18)エコメイト、(15.19)フェンピラザミン(473798-59-3)、(15.20)フルメトベル(154025-04-4)、(15.21)フルオリミド(41205-21-4)、(15.22)

10

20

30

40

50

フルスルファミド (1 0 6 9 1 7 - 5 2 - 6)、(1 5 . 2 3) フルチアニル (3 0 4 9
 0 0 - 2 5 - 2)、(1 5 . 2 4) ホセチル - アルミニウム (3 9 1 4 8 - 2 4 - 8)、
 (1 5 . 2 5) ホセチル - カルシウム、(1 5 . 2 6) ホセチル - ナトリウム (3 9 1 4
 8 - 1 6 - 8)、(1 5 . 2 7) ヘキサクロロベンゼン (1 1 8 - 7 4 - 1)、(1 5 .
 2 8) イルマイシン (8 1 6 0 4 - 7 3 - 1)、(1 5 . 2 9) メタスルホカルブ (6
 6 9 5 2 - 4 9 - 6)、(1 5 . 3 0) イソチオシアン酸メチル (5 5 6 - 6 1 - 6)、
 (1 5 . 3 1) メトラフェノン (2 2 0 8 9 9 - 0 3 - 6)、(1 5 . 3 2) ミルディオ
 マイシン (6 7 5 2 7 - 7 1 - 3)、(1 5 . 3 3) ナタマイシン (7 6 8 1 - 9 3 - 8
)、(1 5 . 3 4) ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル (1 5 5 2 1 - 6 5 - 0)、(1
 5 . 3 5) ニトロタル - イソプロピル (1 0 5 5 2 - 7 4 - 6)、(1 5 . 3 6) オク 10
 チリノン (2 6 5 3 0 - 2 0 - 1)、(1 5 . 3 7) オキサモカルブ (o x a m o c a r b
 b) (9 1 7 2 4 2 - 1 2 - 7)、(1 5 . 3 8) オキシフェンチン (o x y f e n t
 h i i n) (3 4 4 0 7 - 8 7 - 9)、(1 5 . 3 9) ペンタクロロフェノール及び塩 (8
 7 - 8 6 - 5)、(1 5 . 4 0) フェノトリン、(1 5 . 4 1) 亜リン酸及びその塩 (1
 3 5 9 8 - 3 6 - 2)、(1 5 . 4 2) プロパモカルブ - ホセチレート (p r o p a m
 o c a r b - f o s e t y l a t e)、(1 5 . 4 3) プロパノシン - ナトリウム (p r
 o p a n o s i n e - s o d i u m) (8 8 4 9 8 - 0 2 - 6)、(1 5 . 4 4) プロキ
 ナジド (1 8 9 2 7 8 - 1 2 - 4)、(1 5 . 4 5) ピリモルフ (8 6 8 3 9 0 - 9 0 -
 3)、(1 5 . 4 5 e) (2 E) - 3 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 3 - (2 -
 クロロピリジン - 4 - イル) - 1 - (モルホリン - 4 - イル) プロパ - 2 - エン - 1 - オ 20
 ン (1 2 3 1 7 7 6 - 2 8 - 5)、(1 5 . 4 5 z) (2 Z) - 3 - (4 - t e r t - ブ
 チルフェニル) - 3 - (2 - クロロピリジン - 4 - イル) - 1 - (モルホリン - 4 - イル)
) プロパ - 2 - エン - 1 - オン (1 2 3 1 7 7 6 - 2 9 - 6)、(1 5 . 4 6) ピロール
 ニトリン (1 0 1 8 - 7 1 - 9) (E P - A 1 5 5 9 3 2 0)、(1 5 . 4 7) テブフ
 ロキン (3 7 6 6 4 5 - 7 8 - 2)、(1 5 . 4 8) テクロフタラム (7 6 2 8 0 - 9 1
 - 6)、(1 5 . 4 9) トルニファニド (3 0 4 9 1 1 - 9 8 - 6)、(1 5 . 5 0) ト
 リアゾキシド (7 2 4 5 9 - 5 8 - 6)、(1 5 . 5 1) トリクラミド (7 0 1 9 3 - 2
 1 - 4)、(1 5 . 5 2) ザリラミド (8 4 5 2 7 - 5 1 - 5)、(1 5 . 5 3) (3 S
 , 6 S , 7 R , 8 R) - 8 - ベンジル - 3 - [({ 3 - [(イソブチリルオキシ) メトキシ] - 4 -
 メトキシピリジン - 2 - イル } カルボニル) アミノ] - 6 - メチル - 4 , 9 - 30
 ジオキソ - 1 , 5 - ジオキソナン - 7 - イル 2 - メチルプロパノエート (5 1 7 8 7 5
 - 3 4 - 2) (W O 2 0 0 3 0 3 5 6 1 7)、(1 5 . 5 4) 1 - (4 - { 4 - [(5
 R) - 5 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール
 - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) - 2 - [5 - メ
 チル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン (1 0 0 3
 3 1 9 - 7 9 - 6) (W O 2 0 0 8 0 1 3 6 2 2)、(1 5 . 5 5) 1 - (4 - { 4 -
 [(5 S) - 5 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサ
 ザール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) - 2 - [5 -
 メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン (1
 0 0 3 3 1 9 - 8 0 - 9) (W O 2 0 0 8 0 1 3 6 2 2)、(1 5 . 5 6) 1 - (4 - 40
 { 4 - [5 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール
 - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) - 2 - [5 -
 メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン (1 0 0
 3 3 1 8 - 6 7 - 9) (W O 2 0 0 8 0 1 3 6 2 2)、(1 5 . 5 7) 1 - (4 - メト
 キシフェノキシ) - 3 , 3 - ジメチルブタン - 2 - イル 1 H - イミダゾール - 1 - カル
 ボキシレート (1 1 1 2 2 7 - 1 7 - 9)、(1 5 . 5 8) 2 , 3 , 5 , 6 - テトラクロ
 ロ - 4 - (メチルスルホニル) ピリジン (1 3 1 0 8 - 5 2 - 6)、(1 5 . 5 9) 2 ,
 3 - ジブチル - 6 - クロロチエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 (3 H) - オン (2 2 1
 4 5 1 - 5 8 - 7)、(1 5 . 6 0) 2 , 6 - ジメチル - 1 H , 5 H - [1 , 4] ジチイ
 ノ [2 , 3 - c : 5 , 6 - c '] ジピロール - 1 , 3 , 5 , 7 (2 H , 6 H) - テトロン 50

、 (1 5 . 6 1) 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール -
 1 - イル] - 1 - (4 - { 4 - [(5 R) - 5 - フェニル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 -
 オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) エ
 タノン (1 0 0 3 3 1 6 - 5 3 - 7) (W O 2 0 0 8 0 1 3 6 2 2) 、 (1 5 . 6 2)
 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 -
 (4 - { 4 - [(5 S) - 5 - フェニル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3
 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) エタノン (1 0 0 3
 3 1 6 - 5 4 - 8) (W O 2 0 0 8 0 1 3 6 2 2) 、 (1 5 . 6 3) 2 - [5 - メチル
 - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - { 4 - [4 - (5
 - フェニル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル) - 1 , 3 - チアゾー
 ル - 2 - イル] ピペリジン - 1 - イル } エタノン (1 0 0 3 3 1 6 - 5 1 - 5) (W O
 2 0 0 8 0 1 3 6 2 2) 、 (1 5 . 6 4) 2 - ブトキシ - 6 - ヨード - 3 - プロピル - 4
 H - クロメン - 4 - オン、 (1 5 . 6 5) 2 - クロロ - 5 - [2 - クロロ - 1 - (2 , 6
 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 4 - メチル - 1 H - イミダゾール - 5 - イル]
 ピリジン、 (1 5 . 6 6) 2 - フェニルフェノール及び塩 (9 0 - 4 3 - 7) 、 (1 5 .
 6 7) 3 - (4 , 4 , 5 - トリフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 3 , 4 - ジヒドロイソキノ
 リン - 1 - イル) キノリン (8 6 1 6 4 7 - 8 5 - 0) (W O 2 0 0 5 0 7 0 9 1 7)
 、 (1 5 . 6 8) 3 , 4 , 5 - トリクロロピリジン - 2 , 6 - ジカルボニトリル (1 7 8
 2 4 - 8 5 - 0) 、 (1 5 . 6 9) 3 - [5 - (4 - クロロフェニル) - 2 , 3 - ジメチ
 ル - 1 , 2 - オキサゾリジン - 3 - イル] ピリジン、 (1 5 . 7 0) 3 - クロロ - 5 - (4
 - クロロフェニル) - 4 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 6 - メチルピリダジン、
 (1 5 . 7 1) 4 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 3
 , 6 - ジメチルピリダジン、 (1 5 . 7 2) 5 - アミノ - 1 , 3 , 4 - チアジアゾール -
 2 - チオール、 (1 5 . 7 3) 5 - クロロ - N ' - フェニル - N ' - (プロパ - 2 - イン
 - 1 - イル) チオフエン - 2 - スルホノヒドラジド (1 3 4 - 3 1 - 6) 、 (1 5 . 7 4
) 5 - フルオロ - 2 - [(4 - フルオロベンジル) オキシ] ピリミジン - 4 - アミン (1
 1 7 4 3 7 6 - 1 1 - 4) (W O 2 0 0 9 0 9 4 4 4 2) 、 (1 5 . 7 5) 5 - フルオ
 ロ - 2 - [(4 - メチルベンジル) オキシ] ピリミジン - 4 - アミン (1 1 7 4 3 7 6 -
 2 5 - 0) (W O 2 0 0 9 0 9 4 4 4 2) 、 (1 5 . 7 6) 5 - メチル - 6 - オクチル
 [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 7 - アミン、 (1 5 . 7 7) (2
 Z) - 3 - アミノ - 2 - シアノ - 3 - フェニルプロパ - 2 - エン酸エチル、 (1 5 . 7 8
) N ' - (4 - { [3 - (4 - クロロベンジル) - 1 , 2 , 4 - チアジアゾール - 5 - イ
 ル] オキシ } - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミ
 ド、 (1 5 . 7 9) N - (4 - クロロベンジル) - 3 - [3 - メトキシ - 4 - (プロパ -
 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] プロパンアミド、 (1 5 . 8 0) N - [(4 - ク
 ロロフェニル) (シアノ) メチル] - 3 - [3 - メトキシ - 4 - (プロパ - 2 - イン - 1
 - イルオキシ) フェニル] プロパンアミド、 (1 5 . 8 1) N - [(5 - プロモ - 3 - ク
 ロロピリジン - 2 - イル) メチル] - 2 , 4 - ジクロロピリジン - 3 - カルボキサミド、
 (1 5 . 8 2) N - [1 - (5 - プロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル) エチル] - 2
 , 4 - ジクロロピリジン - 3 - カルボキサミド、 (1 5 . 8 3) N - [1 - (5 - プロモ
 - 3 - クロロピリジン - 2 - イル) エチル] - 2 - フルオロ - 4 - ヨードピリジン - 3 -
 カルボキサミド、 (1 5 . 8 4) N - { (E) - [(シクロプロピルメトキシ) イミノ]
 [6 - (ジフルオロメトキシ) - 2 , 3 - ジフルオロフェニル] メチル } - 2 - フェニル
 アセトアミド (2 2 1 2 0 1 - 9 2 - 9) 、 (1 5 . 8 5) N - { (Z) - [(シクロプ
 ロピルメトキシ) イミノ] [6 - (ジフルオロメトキシ) - 2 , 3 - ジフルオロフェニル
] メチル } - 2 - フェニルアセトアミド (2 2 1 2 0 1 - 9 2 - 9) 、 (1 5 . 8 6) N
 ' - { 4 - [(3 - tert - ブチル - 4 - シアノ - 1 , 2 - チアゾール - 5 - イル) オ
 キシ] - 2 - クロロ - 5 - メチルフェニル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミ
 ド、 (1 5 . 8 7) N - メチル - 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル)
) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - N - (1 , 2 ,

3, 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル) - 1, 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミド (922514 - 49 - 6) (WO 2007014290)、(15.88) N - メチル - 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - N - [(1R) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル] - 1, 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミド (922514 - 07 - 6) (WO 2007014290)、(15.89) N - メチル - 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - N - [(1S) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル] - 1, 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミド (922514 - 48 - 5) (WO 2007014290)、(15.90) { 6 - [({ [(1 - メチル - 1H - テトラゾール - 5 - イル) (フェニル) メチルデン] アミノ } オキシ) メチル] ピリジン - 2 - イル } カルバミン酸ベンチル、(15.91) フェナジン - 1 - カルボン酸、(15.92) キノリン - 8 - オール (134 - 31 - 6)、(15.93) キノリン - 8 - オールスルフェート (2 : 1) (134 - 31 - 6)、及び、(15.94) { 6 - [({ [(1 - メチル - 1H - テトラゾール - 5 - イル) (フェニル) メチレン] アミノ } オキシ) メチル] ピリジン - 2 - イル } カルバミン酸 tert - ブチル ;

(16) さらなる化合物、例えば、(16.1) 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - [2' - (トリフルオロメチル) ビフェニル - 2 - イル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(16.2) N - (4' - クロロビフェニル - 2 - イル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(16.3) N - (2', 4' - ジクロロビフェニル - 2 - イル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(16.4) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [4' - (トリフルオロメチル) ビフェニル - 2 - イル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(16.5) N - (2', 5' - ジフルオロビフェニル - 2 - イル) - 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(16.6) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [4' - (プロパ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (WO 2004 / 058723 から既知)、(16.7) 5 - フルオロ - 1, 3 - ジメチル - N - [4' - (プロパ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (WO 2004 / 058723 から既知)、(16.8) 2 - クロロ - N - [4' - (プロパ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] ピリジン - 3 - カルボキサミド (WO 2004 / 058723 から既知)、(16.9) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [4' - (3, 3 - ジメチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (WO 2004 / 058723 から既知)、(16.10) N - [4' - (3, 3 - ジメチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 5 - フルオロ - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (WO 2004 / 058723 から既知)、(16.11) 3 - (ジフルオロメチル) - N - (4' - エチルビフェニル - 2 - イル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (WO 2004 / 058723 から既知)、(16.12) N - (4' - エチルビフェニル - 2 - イル) - 5 - フルオロ - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (WO 2004 / 058723 から既知)、(16.13) 2 - クロロ - N - (4' - エチルビフェニル - 2 - イル) ピリジン - 3 - カルボキサミド (WO 2004 / 058723 から既知)、(16.14) 2 - クロロ - N - [4' - (3, 3 - ジメチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] ピリジン - 3 - カルボキサミド (WO 2004 / 058723 から既知)、(16.15) 4 - (ジフルオロメチル) - 2 - メチル - N - [4' - (トリフルオロメチル) ビフェニル - 2 - イル] - 1, 3 - チアゾール - 5 - カルボキサミド (WO 2004 / 058723 から既知)、(16.16) 5 - フルオロ - N - [4' - (3 - ヒドロキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (WO 20

10

20

30

40

50

04 / 058723 から既知)、(16.17)2 - クロロ - N - [4' - (3 - ヒドロキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル)ピフェニル - 2 - イル]ピリジン - 3 - カルボキサミド (WO 2004 / 058723 から既知)、(16.18)3 - (ジフルオロメチル) - N - [4' - (3 - メトキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル)ピフェニル - 2 - イル] - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (WO 2004 / 058723 から既知)、(16.19)5 - フルオロ - N - [4' - (3 - メトキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル)ピフェニル - 2 - イル] - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (WO 2004 / 058723 から既知)、(16.20)2 - クロロ - N - [4' - (3 - メトキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル)ピフェニル - 2 - イル]ピリジン - 3 - カルボキサミド (WO 2004 / 058723 から既知)、(16.21)(5 - プロモ - 2 - メトキシ - 4 - メチルピリジン - 3 - イル)(2, 3, 4 - トリメトキシ - 6 - メチルフェニル)メタノン (EP - A 1559320 から既知)、(16.22)N - [2 - (4 - {[3 - (4 - クロロフェニル)プロパ - 2 - イン - 1 - イル]オキシ} - 3 - メトキシフェニル)エチル] - N2 - (メチルスルホニル)パリンアミド (220706 - 93 - 4)、(16.23)4 - オキソ - 4 - [(2 - フェニルエチル)アミノ]ブタン酸、及び、(16.24)ブタ - 3 - イン - 1 - イル {6 - [(Z) - (1 - メチル - 1H - テトラゾール - 5 - イル)(フェニル)メチレン]アミノ}オキシ)メチル]ピリジン - 2 - イル}カルバメート。

10

20

【0074】

上記で挙げられているクラス(1)~クラス(16)の全ての混合相手剤は、それらに有している官能基によって可能である場合には、適切な塩基又は酸と塩を形成することができる。

【0075】

混合相手の適切な殺細菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤又は殺線虫剤の例は、下記リストの中から選択することができる。

【0076】

殺細菌剤：

プロノポール、ジクロロフェン、ニトラピリン、ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、カスガマイシン、オクチリノン、フランカルボン酸、オキシテトラサイクリン、プロベナゾール、ストレプトマイシン、テクロフタラム、硫酸銅及び他の銅剤。

30

【0077】

殺虫剤 / 殺ダニ剤 / 殺線虫剤：(1) アセチルコリンエステラーゼ (AChE) 阻害薬、例えば、

カーバメート系、例えば、アラニカルブ、アルジカルブ、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、プトカルボキシム、プトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフエンカルブ、フェノブカルブ、ホルメタネート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メソミル、メトルカルブ、オキサミル、ピリミカーブ、プロボクスル、チオジカルブ、チオフアノックス、トリアザメート、トリメタカルブ、XMC、及び、キシリルカルブ；又は、

40

有機リン酸エステル系、例えば、アセフェート、アザメチホス、アジンホス - エチル、アジンホス - メチル、カズサホス、クロルエトキシホス、クロルフェンピンホス、クロルメホス、クロルピリホス、クロルピリホス - メチル、クマホス、シアノホス、ジメトン - S - メチル、ダイアジノン、ジクロロボス / DDVP、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルピンホス、ダイスルホトン、EPN、エチオン、エトプロホス、ファミフル、フェナミホス、フェントロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イミシアホス、イソフェンホス、O - (メトキシアミノチオホスホリル)サリチル酸イソプロピル、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メピンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシジメトン - メチル、パラチオン、パラチオン - メチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン

50

、ホキシム、ピリミホス - メチル、プロフェノホス、プロペタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリムホス、テメホス、テルブホス、テトラクロルピンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホン、及び、パミドチオン；

(2) GABA制御塩化物チャンネル拮抗薬、例えば、

シクロジエン有機塩素系、例えば、クロルダン、及び、エンドスルファン；又は、フェニルピラゾール系（フィプロール系）、例えば、エチプロール、及び、フィプロニル；

(3) ナトリウムチャンネルモジュレーター/電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬、例えば、

ピレスロイド系、例えば、アクリナトリン、アレスリン、d - シス - トランスアレスリン、d - トランスアレスリン、ピフェントリン、ピオアレスリン、ピオアレスリン S - シクロペンテニル異性体、ピオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベータ - シフルトリン、シハロトリン、ラムダ - シハロトリン、ガンマ - シハロトリン、シペルメトリン、アルファ - シペルメトリン、ベータ - シペルメトリン、シータ - シペルメトリン、ゼータ - シペルメトリン、シフェノトリン [(1 R) - トランス異性体]、デルタメトリン、エムペントリン [(E Z) - (1 R) 異性体]、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウ - フルバリネート、ハルフェンプロックス、イミプロトリン、カデトリン、ベルメトリン、フェノトリン [(1 R) - トランス異性体]]、プラレトリン、ピレトリン（除虫菊（pyrethrum））、レスメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメトリン、テトラメトリン [(1 R) 異性体]、トラロメトリン、及び、トランスフルトリン；又は、

DDT；又は、メトキシクロル；

(4) ニコチン性アセチルコリン受容体（nAChR）作動薬、例えば、

ネオニコチノイド系、例えば、アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、チアクロプリド、及び、チアメトキサム；又は、ニコチン；

(5) ニコチン性アセチルコリン受容体（nAChR）アロステリック活性化薬、例えば、

スピノシン系、例えば、スピネトラム、及び、スピノサド；

(6) 塩化物チャンネル活性化薬、例えば、

アベルメクチン系/ミルベマイシン系、例えば、アバメクチン、エマメクチン安息香酸塩、レピメクチン、及び、ミルベメクチン；

(7) 幼若ホルモンミミック、例えば、

幼若ホルモン類似体、例えば、ハイドロプレン、キノプレン、及び、メトプレン；又は、

フェノキシカルブ；又は、ピリプロキシフェン；

(8) 種々の非特異的（多部位）阻害薬、例えば、

ハロゲン化アルキル系、例えば、臭化メチル、及び、別のハロゲン化アルキル；又は、クロロピクリン；又は、フッ化スルフルル；又は、ホウ砂；又は、吐酒石；

(9) 選択的同翅類摂食阻害薬、例えば、

ピメトロジン；又は、フロニカミド；

(10) ダニ成長阻害薬、例えば、

クロフェンテジン、ヘキシチアゾクス、及び、ジフロピダジン；又は、エトキサゾール；

(11) 昆虫中腸膜の微生物ディスラプター、例えば、

バシルス・ツリングエンシス・亜種・イスラエレンシス（*Bacillus thuringiensis subspecies israelensis*）、バシルス・スファエリクス（*Bacillus sphaericus*）、バシルス・ツリングエンシ

10

20

30

40

50

ス・亜種・アイザワイ (*Bacillus thuringiensis subspecies aizawai*)、バシルス・ツリングエンシス・亜種・クルスタキ (*Bacillus thuringiensis subspecies kurstaki*)、バシルス・ツリングエンシス・亜種・テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis subspecies tenebrionis*)、及び、BT作物タンパク質：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34/35Ab1；

(12) ミトコンドリアATPシンターゼの阻害薬、例えば、
ジアフェンチウロン；又は、

有機スズ系殺ダニ薬、例えば、アゾシクロチン、シヘキサチン、及び、酸化フェンブタスズ；又は、

プロパルギット；又は、テトラジホン；

(13) プロトン勾配を破壊することによる酸化的リン酸化の脱共役剤、例えば、
クロルフェナビル、DNOC、及び、スルフルアミド；

(14) ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR) チャンネル遮断薬、例えば

、
ベンスルタップ、カルタップ塩酸塩、チオシクラム、及び、チオスルタップ-ナトリウム；

(15) キチン生合成の阻害薬 (タイプ0)、例えば、

ピストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、ノピフルムロン、テフルベンズロン、及び、トリフルムロン；

(16) キチン生合成の阻害薬 (タイプ1)、例えば、

ブプロフェジン；

(17) 脱皮攪乱剤 (moulting disruptor)、例えば、
シロマジン；

(18) エクジソン受容体作動薬、例えば、

クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、及び、テブフェノジド；

(19) オクトパミン受容体作動薬、例えば、

アミトラズ；

(20) ミトコンドリア複合体III電子伝達阻害薬、例えば、

ヒドラメチルノン；又は、アセキノシル；又は、フルアクリピリム；

(21) ミトコンドリア複合体I電子伝達阻害薬、例えば、

METI殺ダニ剤、例えば、フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラド、及び、トルフェンピラド；又は、
ロテノン (Derris)；

(22) 電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬、例えば、

インドキサカルブ；又は、メタフルミゾン；

(23) アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害薬、例えば、

テロン酸誘導体及びテトラミン酸誘導体、例えば、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、及び、スピロテトラマト；

(24) ミトコンドリア複合体IV電子伝達阻害薬、例えば、

ホスフィン系、例えば、リン化アルミニウム、リン化カルシウム、ホスフィン、及び、リン化亜鉛；又は、

シアン化物；

(25) ミトコンドリア複合体II電子伝達阻害薬、例えば、

シエノピラフェン；

(28) リアノジン受容体モジュレーター、例えば、

ジアミド系、例えば、クロラントラニリプロール、及び、フルベンジアミド。

【0078】

10

20

30

40

50

作用機序が知られていないか又は確定していないさらなる活性成分、例えば、アミドフルメト、アザジラクチン、ベンクロチアズ、ベンゾキシメート、ピフェナゼート、プロモプロピレート、キノメチオナート、氷晶石(cryolite)、シアントラニリプロール(シアジピル)、シフルメトフェン、ジコホル、ジフロビダジン(diflovidazin)、フルエンシルホン、フルフェネリム、フルフィプロール(flufiprole)、フルオピラム、フフェノジド(fufenozide)、イミダクロチズ、イプロジオン、メベルフルトリン(meperfluthrin)、ピリダリル、ピリフルキナゾン、テトラメチルフルトリン(tetramethylfluthrin)、及び、ヨードメタン；パシルス・フィルムス(Bacillus firmus)に基づくさらなる製品(これは、限定するものではないが、以下のものを包含する：株CNCMI-1582、例えば、VOTiVO^TM, BioNem)、又は、以下の既知活性化合物のうちの1種類：3-プロモ-N-{2-プロモ-4-クロロ-6-[(1-シクロプロピルエチル)カルバモイル]フェニル}-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド(WO2005/077934から既知)、4-{ [(6-プロモピリジン-3-イル)メチル](2-フルオロエチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(WO2007/115644から既知)、4-{ [(6-フルオロピリジン-3-イル)メチル](2,2-ジフルオロエチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(WO2007/115644から既知)、4-{ [(2-クロロ-1,3-チアゾール-5-イル)メチル](2-フルオロエチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(WO2007/115644から既知)、4-{ [(6-クロロピリジン-3-イル)メチル](2-フルオロエチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(WO2007/115644から既知)、フルピラジフロン(flupyradifurone)、4-{ [(6-クロロ-5-フルオロピリジン-3-イル)メチル](メチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(WO2007/115643から既知)、4-{ [(5,6-ジクロロピリジン-3-イル)メチル](2-フルオロエチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(WO2007/115646から既知)、4-{ [(6-クロロ-5-フルオロピリジン-3-イル)メチル](シクロプロピル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(WO2007/115643から既知)、4-{ [(6-クロロピリジン-3-イル)メチル](シクロプロピル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(EP-A-0539588から既知)、4-{ [(6-クロロピリジン-3-イル)メチル](メチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(EP-A-0539588から既知)、{ [1-(6-クロロピリジン-3-イル)エチル](メチル)オキシド-⁴-スルファニリデン}シアナミド(WO2007/149134から既知)及びそのジアステレオマー{ [(1R)-1-(6-クロロピリジン-3-イル)エチル](メチル)オキシド-⁴-スルファニリデン}シアナミド(A)及び{ [(1S)-1-(6-クロロピリジン-3-イル)エチル](メチル)オキシド-⁴-スルファニリデン}シアナミド(B)(同様に、WO2007/149134から既知)、並びに、スルホキサフロル及びそのジアステレオマー[(R)-メチル(オキシド){ (1R)-1-[6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]エチル}-⁴-スルファニリデン]シアナミド(A1)及び[(S)-メチル(オキシド){ (1S)-1-[6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]エチル}-⁴-スルファニリデン]シアナミド(A2)(ジアステレオマーAの群と称される)(WO2010/074747、WO2010/074751から既知)、[(R)-メチル(オキシド){ (1S)-1-[6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]エチル}-⁴-スルファニリデン]シアナミド(B1)及び[(S)-メチル(オキシド){ (1R)-1-[6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]エチル}-⁴-スルファニリデン]シアナミド(B2)(ジアステレオマーBの群と称される)(同様に、WO2010/074747、WO2010/074751から既知)、並びに、11-(4-クロロ-2,6-ジメチルフェニル)-12-ヒドロキシ-1,4-ジオキサ-9-アザジスピロ[4.2.4.2]テトラデカ-11-エン-10-オン(WO2006/089633から既知)、3-(4'-フルオロ-2,4-ジメチルピ

フェニル - 3 - イル) - 4 - ヒドロキシ - 8 - オキサ - 1 - アザスピロ [4 . 5] デカ - 3 - エン - 2 - オン (W O 2 0 0 8 / 0 6 7 9 1 1 から既知)、 1 - { 2 - フルオロ - 4 - メチル - 5 - [(2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) スルフィニル] フェニル } - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 5 - アミン (W O 2 0 0 6 / 0 4 3 6 3 5 から既知)、 [(3 S , 4 a R , 1 2 R , 1 2 a S , 1 2 b S) - 3 - [(シクロプロピルカルボニル) オキシ] - 6 , 1 2 - ジヒドロキシ - 4 , 1 2 b - ジメチル - 1 1 - オキソ - 9 - (ピリジン - 3 - イル) - 1 , 3 , 4 , 4 a , 5 , 6 , 6 a , 1 2 , 1 2 a , 1 2 b - デカヒドロ - 2 H , 1 1 H - ベンゾ [f] ピラノ [4 , 3 - b] クロメン - 4 - イル] メチル シクロプロパンカルボキシレート (W O 2 0 0 8 / 0 6 6 1 5 3 から既知)、 2 - シアノ - 3 - (ジフルオロメトキシ) - N , N - ジメチルベンゼンスルホンアミド (W O 2 0 0 6 / 0 5 6 4 3 3 から既知)、 2 - シアノ - 3 - (ジフルオロメトキシ) - N - メチルベンゼンスルホンアミド (W O 2 0 0 6 / 1 0 0 2 8 8 から既知)、 2 - シアノ - 3 - (ジフルオロメトキシ) - N - エチルベンゼンスルホンアミド (W O 2 0 0 5 / 0 3 5 4 8 6 から既知)、 4 - (ジフルオロメトキシ) - N - エチル - N - メチル - 1 , 2 - ベンゾチアゾール - 3 - アミン 1 , 1 - ジオキシド (W O 2 0 0 7 / 0 5 7 4 0 7 から既知)、 N - [1 - (2 , 3 - ジメチルフェニル) - 2 - (3 , 5 - ジメチルフェニル) エチル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 3 - チアゾール - 2 - アミン (W O 2 0 0 8 / 1 0 4 5 0 3 から既知)、 { 1 ' - [(2 E) - 3 - (4 - クロロフェニル) プロパ - 2 - エン - 1 - イル] - 5 - フルオロスピロ [インドール - 3 , 4 ' - ピペリジン] - 1 (2 H) - イル } (2 - クロロピリジン - 4 - イル) メタノン (W O 2 0 0 3 / 1 0 6 4 5 7 から既知)、 3 - (2 , 5 - ジメチルフェニル) - 4 - ヒドロキシ - 8 - メトキシ - 1 , 8 - ジアザスピロ [4 . 5] デカ - 3 - エン - 2 - オン (W O 2 0 0 9 / 0 4 9 8 5 1 から既知)、 3 - (2 , 5 - ジメチルフェニル) - 8 - メトキシ - 2 - オキソ - 1 , 8 - ジアザスピロ [4 . 5] デカ - 3 - エン - 4 - イル エチル カルボネート (W O 2 0 0 9 / 0 4 9 8 5 1 から既知)、 4 - (ブタ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) - 6 - (3 , 5 - ジメチルピペリジン - 1 - イル) - 5 - フルオロピリミジン (W O 2 0 0 4 / 0 9 9 1 6 0 から既知)、 (2 , 2 , 3 , 3 , 4 , 4 , 5 , 5 - オクタフルオロペンチル) (3 , 3 , 3 - トリフルオロプロピル) マロノニトリル (W O 2 0 0 5 / 0 6 3 0 9 4 から既知)、 (2 , 2 , 3 , 3 , 4 , 4 , 5 , 5 - オクタフルオロペンチル) (3 , 3 , 4 , 4 , 4 - ペンタフルオロブチル) マロノニトリル (W O 2 0 0 5 / 0 6 3 0 9 4 から既知)、 8 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 4 - (トリフルオロメチル) フェノキシ] - 3 - [6 - (トリフルオロメチル) ピリダジン - 3 - イル] - 3 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクタン (W O 2 0 0 7 / 0 4 0 2 8 0 から既知)、 フロメトキン (f l o m e t o q u i n)、 P F 1 3 6 4 (C A S - R e g . N o . 1 2 0 4 7 7 6 - 6 0 - 2) (J P 2 0 1 0 / 0 1 8 5 8 6 から既知)、 5 - [5 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 2 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) ベンゾニトリル (W O 2 0 0 7 / 0 7 5 4 5 9 から既知)、 5 - [5 - (2 - クロロピリジン - 4 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 2 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) ベンゾニトリル (W O 2 0 0 7 / 0 7 5 4 5 9 から既知)、 4 - [5 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 2 - メチル - N - { 2 - オキソ - 2 - [(2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) アミノ] エチル } ベンズアミド (W O 2 0 0 5 / 0 8 5 2 1 6 から既知)、 4 - { [(6 - クロロピリジン - 3 - イル) メチル] (シクロプロピル) アミノ } - 1 , 3 - オキサゾール - 2 (5 H) - オン、 4 - { [(6 - クロロピリジン - 3 - イル) メチル] (2 , 2 - ジフルオロエチル) アミノ } - 1 , 3 - オキサゾール - 2 (5 H) - オン、 4 - { [(6 - クロロピリジン - 3 - イル) メチル] (エチル) アミノ } - 1 , 3 - オキサゾール - 2 (5 H) - オン、 4 - { [(6 - クロロピリジン - 3 - イル) メチル] (メチル) アミノ } - 1 , 3 - オキサゾール - 2 (5 H) - オン (これらは、全て、 W O 2 0 1 0 / 0 0 5 6 9 2 から既知)、 N N I - 0 7 1 1

10

20

30

40

50

(WO 2002/096882 から既知)、1 - アセチル - N - [4 - (1 , 1 , 1 , 3 , 3 , 3 - ヘキサフルオロ - 2 - メトキシプロパン - 2 - イル) - 3 - イソブチルフェニル] - N - イソブチリル - 3 , 5 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (WO 2002/096882 から既知)、2 - [2 - ({ [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] カルボニル } アミノ) - 5 - クロロ - 3 - メチルベンゾイル] - 2 - メチルヒドラジンカルボン酸メチル (WO 2005/085216 から既知)、2 - [2 - ({ [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] カルボニル } アミノ) - 5 - シアノ - 3 - メチルベンゾイル] - 2 - エチルヒドラジンカルボン酸メチル (WO 2005/085216 から既知)、2 - [2 - ({ [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] カルボニル } アミノ) - 5 - シアノ - 3 - メチルベンゾイル] - 2 - メチルヒドラジンカルボン酸メチル (WO 2005/085216 から既知)、2 - [3 , 5 - ジプロモ - 2 - ({ [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] カルボニル } アミノ) ベンゾイル] - 1 , 2 - ジエチルヒドラジンカルボン酸メチル (WO 2005/085216 から既知)、2 - [3 , 5 - ジプロモ - 2 - ({ [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] カルボニル } アミノ) ベンゾイル] - 2 - エチルヒドラジンカルボン酸メチル (WO 2005/085216 から既知)、(5 RS , 7 RS ; 5 RS , 7 SR) - 1 - (6 - クロロ - 3 - ピリジルメチル) - 1 , 2 , 3 , 5 , 6 , 7 - ヘキサヒドロ - 7 - メチル - 8 - ニトロ - 5 - プロボキシイミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン (WO 2007/101369 から既知)、2 - { 6 - [2 - (5 - フルオロピリジン - 3 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 5 - イル] ピリジン - 2 - イル } ピリミジン (WO 2010/006713 から既知)、2 - { 6 - [2 - (ピリジン - 3 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 5 - イル] ピリジン - 2 - イル } ピリミジン (WO 2010/006713 から既知)、1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - N - [4 - シアノ - 2 - メチル - 6 - (メチルカルバモイル) フェニル] - 3 - { [5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - テトラゾール - 1 - イル] メチル } - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (WO 2010/069502 から既知)、1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - N - [4 - シアノ - 2 - メチル - 6 - (メチルカルバモイル) フェニル] - 3 - { [5 - (トリフルオロメチル) - 2 H - テトラゾール - 2 - イル] メチル } - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (WO 2010/069502 から既知)、N - [2 - (tert - ブチルカルバモイル) - 4 - シアノ - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 3 - { [5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - テトラゾール - 1 - イル] メチル } - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (WO 2010/069502 から既知)、N - [2 - (tert - ブチルカルバモイル) - 4 - シアノ - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 3 - { [5 - (トリフルオロメチル) - 2 H - テトラゾール - 2 - イル] メチル } - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (WO 2010/069502 から既知)、(1 E) - N - [(6 - クロロピリジン - 3 - イル) メチル] - N ' - シアノ - N - (2 , 2 - ジフルオロエチル) エタンイミドアミド (WO 2008/009360 から既知)、N - [2 - (5 - アミノ - 1 , 3 , 4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 4 - クロロ - 6 - メチルフェニル] - 3 - プロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (CN 102057925 から既知)、及び、2 - [3 , 5 - ジプロモ - 2 - ({ [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] カルボニル } アミノ) ベンゾイル] - 2 - エチル - 1 - メチルヒドラジンカルボン酸メチル (WO 2011/049233 から既知)。

10

20

30

40

【 0079 】

別の既知活性化合物 (例えば、除草剤) との混合物、又は、肥料及び成長調節剤、薬害軽減剤若しくは情報化学物質などとの混合物も可能である。

【 0080 】

50

さらに、本発明による式(I)で表される化合物は、極めて優れた抗真菌活性も示す。それらは、極めて広い抗真菌活性スペクトルを有しており、特に、皮膚糸状菌、並びに、発芽しつつある真菌類、カビ類及び二相性真菌類に対して〔例えば、カンジダ属各種(*Candida species*)、例えば、カンジダ・アルビカンス(*Candida albicans*)、カンジダ・グラブラタ(*Candida glabrata*)に対して〕、並びに、エピデルモフィトン・フロコスム(*Epidermophyton floccosum*)、アスペルギルス属各種(*Aspergillus species*)、例えば、アスペルギルス・ニゲル(*Aspergillus niger*)及びアスペルギルス・フミガツス(*Aspergillus fumigatus*)、トリコフィトン属各種(*Trichophyton species*)、例えば、トリコフィトン・メンタグロフィテス(*Trichophyton mentagrophytes*)、ミクロスポロン属各種(*Microsporon species*)、例えば、ミクロスポロン・カニス(*Microsporon canis*)及びミクロスポロン・アウドウイニイ(*Microsporon audouinii*)などに対して、極めて広い抗真菌活性スペクトルを有している。これら菌類のリストは、防除可能な真菌スペクトルを決して限定するものではなく、単に例示のためのものである。

10

【0081】

式(I)で表される化合物及び本発明の殺菌剤組成物を使用して、植物又は作物の植物病原性菌類を治療的又は予防的に防除することができる。

20

【0082】

かくして、本発明のさらなる態様により、植物又は作物の植物病原性菌類を治療的又は予防的に防除する方法が提供され、ここで、該方法は、式(I)で表される化合物又は本発明の殺菌剤組成物を、種子、植物若しくは植物の果実に施用するか、又は、植物がそこで生育している土壌若しくは植物を栽培するのが望まれる土壌に施用することを特徴とする。

【0083】

本発明による処理方法は、さらにまた、塊茎又は根茎のような繁殖器官を処理するのにも有効であり得、さらには、種子、実生又は移植実生(*seedlings pricking out*)及び植物又は移植植物(*plants pricking out*)を処理するのにも有効であり得る。この処理方法は、根を処理するのにも有効であり得る。本発明による処理方法は、関係している植物の樹幹、茎又は柄、葉、花及び果実のような植物の地上部を処理するのにも有効であり得る。

30

【0084】

本発明に従って、全ての植物及び植物の部分进行处理することができる。植物は、望ましい及び望ましくない野生植物、栽培品種並びに植物変種(植物変種又は植物育種家の権利によって保護されても又は保護されなくても)のような全ての植物及び植物群を意味する。栽培品種及び植物変種は、慣習的な繁殖方法及び育種方法(これらは、1種類以上の生物工学的的方法によって、例えば、倍加半数体、プロトプラスト融合、ランダム突然変異誘発及び定方向突然変異誘発、分子標識若しくは遺伝標識又は生物工学法及び遺伝子工学法などを使用して、補助することができるか又は補うことができる)によって得られる植物であることができる。植物の部分は、植物の地上及び地下の全ての部分及び全ての器官、例えば、枝条、葉、花及び根などを意味し、ここで、例えば、葉、針状葉、茎、枝、花、子実体、果実及び種子、並びに、根、球茎及び根茎などを挙げるることができる。作物並びに栄養繁殖器官及び生殖繁殖器官(*vegetative and generative propagating material*)、例えば、挿木(*cutting*)、球茎、根茎、匍匐茎及び種子なども、植物の部分に属する。

40

【0085】

本発明の方法で保護することが可能な植物の中で、以下のものを挙げるができる：主要農作物、例えば、トウモロコシ、ダイズ、ワタ、アブラナ属油料種子(*Brassica oilseeds*)、例えば、セイヨウアブラナ(*Brassica napus*)

50

) (例えば、カノラ)、カブ (*Brassica rapa*)、カラシナ (*B. juncea*) (例えば、マスタード) 及びアビシニアガラシ (*Brassica carinata*)、イネ、コムギ、テンサイ、サトウキビ、エンバク、ライムギ、オオムギ、アワ、ライコムギ、アマ、ブドウの木、並びに、種々の植物学的分類群に属するさまざまな果実及び野菜、例えば、バラ科各種 (*Rosaceae* sp.) (例えば、仁果 (pipp fruit)、例えば、リンゴ及びナシ、さらに、核果、例えば、アンズ、サクラ、アーモンド及びモモ、液果 (berry fruits)、例えば、イチゴ)、リベシオイダ工科各種 (*Ribesioideae* sp.)、クルミ科各種 (*Juglandaceae* sp.)、カバノキ科各種 (*Betulaceae* sp.)、ウルシ科各種 (*Anacardiaceae* sp.)、ブナ科各種 (*Fagaceae* sp.)、クワ科各種 (*Moraceae* sp.)、モクセイ科各種 (*Oleaceae* sp.)、マタビ科各種 (*Actinidaceae* sp.)、クスノキ科各種 (*Lauraceae* sp.)、パショウ科各種 (*Musaceae* sp.) (例えば、バナナの木及びバナナ園 (banana trees and plantings))、アカネ科各種 (*Rubiaceae* sp.) (例えば、コーヒー)、ツバキ科各種 (*Theaceae* sp.)、アオギリ科各種 (*Sterculiaceae* sp.)、ミカン科各種 (*Rutaceae* sp.) (例えば、レモン、オレンジ及びグレープフルーツ); ナス科各種 (*Solanaceae* sp.) (例えば、トマト、ジャガイモ、トウガラシ、ナス)、ユリ科各種 (*Liliaceae* sp.)、キク科各種 (*Compositae* sp.) (例えば、レタス、チョウセンアザミ及びチコリー (これは、ルートチコリー (root chicory)、エンダイブ又はキクニガナを包含する))、セリ科各種 (*Umbelliferae* sp.) (例えば、ニンジン、パセリ、セロリ及びセルリアック)、ウリ科各種 (*Cucurbitaceae* sp.) (例えば、キュウリ (これは、ピクルキュウリ (pickling cucumber) を包含する)、カボチャ、スイカ、ヒョウタン及びメロン)、ネギ科各種 (*Alliaceae* sp.) (例えば、タマネギ及びリーキ)、アブラナ科各種 (*Cruciferae* sp.) (例えば、白キャベツ、赤キャベツ、ブロッコリー、カリフラワー、芽キャベツ、タイサイ、コールラビ、ラディッシュ、セイヨウワサビ、コショウソウ、ハクサイ)、マメ科各種 (*Leguminosae* sp.) (例えば、ラッカセイ、エンドウ及びインゲンマメ (例えば、クライミングビーン (climbing beans) 及びソラマメ))、アカザ科各種 (*Chenopodiaceae* sp.) (例えば、フダンソウ (mangold)、フダンソウ (spinach beet)、ホウレンソウ、ビートルート)、アオイ科 (*Malvaceae*) (例えば、オクラ)、クサスギカズラ科 (*Asparagaceae*) (例えば、アスパラガス); 園芸作物及び森林作物 (forest crops); 観賞植物; 及び、これら作物の遺伝子組み換えが行われた相同物。

【0086】

本発明による処理方法は、遺伝子組換え生物 (GMO)、例えば、植物又は種子などの処理において使用することができる。遺伝子組換え植物 (又は、トランスジェニック植物) は、異種遺伝子がゲノムに安定的に組み込まれている植物である。表現「異種遺伝子」は、本質的に、供給されたか又は当該植物の外部で構築された遺伝子であって、核のゲノム、葉緑体のゲノム又はミトコンドリアのゲノムの中に導入されたときに、興味深いタンパク質若しくはポリペプチドを発現することにより、又は、その植物内に存在している別の1つ若しくは複数の遺伝子をダウンレギュレート若しくはサイレンシングすることにより、当該形質転換された植物に新しい又は改善された作物学的特性又は別の特性を付与する遺伝子を意味する [例えば、アンチセンス技術、コサプレッション技術又はRNA干渉 (RNAi) 技術などを使用する]。ゲノム内に位置している異種遺伝子は、導入遺伝子とも称される。植物ゲノム内におけるその特異的な位置によって定義される導入遺伝子は、形質転換又は遺伝子導入イベントと称される。

【0087】

植物種又は植物品種、それらの生育場所及び生育条件 (土壌、気候、生育期、養分 (d

iet)) に応じて、本発明の処理により、相加効果を超える効果(「相乗効果」)も生じ得る。かくして、例えば、本発明により使用し得る活性化合物及び組成物の施用量の低減及び/又は活性スペクトルの拡大及び/又は活性の増強、植物の生育の向上、高温又は低温に対する耐性の向上、湯水又は水中若しくは土壌中に含まれる塩分に対する耐性の向上、開花能力の向上、収穫の容易性の向上、促進された成熟、収穫量の増加、果実の大きさの増大、植物の高さの増大、葉の緑色の向上、より早い開花、収穫された生産物の品質の向上及び/又は栄養価の増加、果実内の糖度の上昇、収穫された生産物の貯蔵安定性の向上及び/又は加工性の向上などが可能であり、これらは、実際に予期された効果を超えるものである。

【0088】

特定の施用量において、本発明による活性化合物組合せは、植物において強化効果(strengthening effect)も示し得る。従って、本発明の活性化合物組合せは、望ましくない微生物類による攻撃に対して植物の防御システムを動員させるのにも適している。これは、適切な場合には、本発明による組合せの例えば菌類に対する強化された活性の理由のうちの一つであり得る。本発明に関連して、植物を強化する(抵抗性を誘導する)物質は、処理された植物が、その後で望ましくない微生物類を接種されたときに、それらの微生物類に対して実質的な程度の抵抗性を示すように、植物の防御システムを刺激することができる物質又は物質の組合せを意味するものと理解される。この場合、望ましくない微生物類は、植物病原性の菌類、細菌類及びウイルス類を意味するものと理解される。従って、処理後特定の期間、上記病原体による攻撃から植物を保護するために、本発明の物質を用いることができる。保護が達成される期間は、植物が該活性化合物で処理されてから、一般に、1~10日間、好ましくは、1~7日間である。

【0089】

本発明に従って処理するのが好ましい植物及び植物品種は、特に有利で有益な形質を植物に付与する遺伝物質を有している全ての植物(育種によって得られたものであろうと、及び/又は、生物工学的的方法によって得られたものであろうと)を包含する。

【0090】

本発明に従って処理するのが同様に好ましい植物及び植物品種は、1以上の生物的ストレスに対して抵抗性を示す。即ち、そのような植物は、害虫及び有害微生物に対して、例えば、線虫類、昆虫類、ダニ類、植物病原性の菌類、細菌類、ウイルス類及び/又はウィロイド類などに対して、良好な防御を示す。

【0091】

線虫抵抗性植物の例は、例えば、米国特許出願第11/765,491号、米国特許出願第11/765,494号、米国特許出願第10/926,819号、米国特許出願第10/782,020号、米国特許出願第12/032,479号、米国特許出願第10/783,417号、米国特許出願第10/782,096号、米国特許出願第11/657,964号、米国特許出願第12/192,904号、米国特許出願第11/396,808号、米国特許出願第12/166,253号、米国特許出願第12/166,239号、米国特許出願第12/166,124号、米国特許出願第12/166,209号、米国特許出願第11/762,886号、米国特許出願第12/364,335号、米国特許出願第11/763,947号、米国特許出願第12/252,453号、米国特許出願第12/209,354号、米国特許出願第12/491,396号又は米国特許出願第12/497,221号などに記載されている。

【0092】

本発明に従って同様に処理し得る植物及び植物品種は、1以上の非生物的ストレスに対して抵抗性を示す植物である。非生物的なストレス状態としては、例えば、湯水、低温に晒されること、熱に晒されること、浸透ストレス、湛水、土壌中の塩分濃度の上昇、より多くの鉢物に晒されること、オゾンに晒されること、強い光に晒されること、利用可能な窒素養分が限られていること、利用可能なリン養分が限られていること、日陰回避などを挙げることができる。

10

20

30

40

50

【0093】

本発明に従って同様に処理し得る植物及び植物品種は、増大した収量特性を特徴とする植物である。そのような植物における増大した収量は、例えば、改善された植物の生理機能、生長及び発育、例えば、水の利用効率、水の保持効率、改善された窒素の利用性、強化された炭素同化作用、改善された光合成、上昇した発芽効率及び促進された成熟などの結果であり得る。収量は、さらに、改善された植物の構成 (architecture) によっても影響され得る (ストレス条件下及び非ストレス条件下)。そのような改善された植物の構成としては、限定するものではないが、早咲き、ハイブリッド種子産生のための開花制御、実生の活力、植物の寸法、節間の数及び距離、根の成長、種子の寸法、果実の寸法、莢の寸法、莢又は穂の数、1つの莢又は穂当たりの種子の数、種子の体積、強化された種子充填、低減された種子分散、低減された莢の裂開及び耐倒伏性などがある。収量についてのさらなる形質としては、種子の組成、例えば、炭水化物含有量、タンパク質含有量、油含有量及び油の組成、栄養価、抗栄養化合物の低減、改善された加工性並びに向上した貯蔵安定性などがある。

10

【0094】

上記形質を有している植物の例は、表Aの中に非網羅的に挙げられている。

【0095】

本発明に従って処理し得る植物は、雑種強勢 (これは、結果として、一般に、増加した収量、向上した活力、向上した健康状態並びに生物的及び非生物的ストレスに対する向上した抵抗性をもたらす) の特性を既に呈しているハイブリッド植物である。そのような植物は、典型的には、雄性不稔交配母体近交系 (inbred male-sterile parent line) (雌性親) を別の雄性稔性交配母体近交系 (inbred male-fertile parent line) (雄性親) と交雑させることによって作られる。ハイブリッド種子は、典型的には、雄性不稔植物から収穫され、そして、栽培者に販売される。雄性不稔植物は、場合により (例えば、トウモロコシにおいて)、雄穂を除去することによって (即ち、雄性繁殖器官 (又は雄花) を機械的に除去することによって)、作ることができる。しかしながら、より典型的には、雄性不稔性は、植物ゲノム内の遺伝的決定基の結果である。その場合、及び、特に種子がハイブリッド植物から収穫される所望の生産物である場合、典型的には、該ハイブリッド植物において雄性稔性を確実に完全に回復させることは有用である。これは、雄性不稔性に関する遺伝的決定基を含んでいるハイブリッド植物において雄性稔性を回復させることが可能な適切な稔性回復遺伝子を雄性親が有していることを確実なものとすることによって達成することができる。雄性不稔性に関する遺伝的決定基は、細胞質内に存在し得る。細胞質雄性不稔 (CMS) の例は、例えば、アブラナ属各種 (Brassica species) に関して記述された (WO 92/05251、WO 95/09910、WO 98/27806、WO 05/002324、WO 06/021972、及び、US 6,229,072)。しかしながら、雄性不稔性に関する遺伝的決定基は、核ゲノム内にも存在し得る。雄性不稔性植物は、遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によっても得ることができる。雄性不稔性植物を得る特に有用な方法は、WO 89/10396に記載されており、ここでは、例えば、バルナーゼなどのリボヌクレアーゼを雄ずい内のタペータム細胞において選択的に発現させる。次いで、タペータム細胞内においてバルスターなどのリボヌクレアーゼインヒビターを発現させることによって、稔性を回復させることができる (例えば、WO 91/02069)。

20

30

40

【0096】

本発明に従って処理し得る植物又は植物品種 (遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られたもの) は、除草剤耐性植物、即ち、1種類以上の所与の除草剤に対して耐性にされた植物である。そのような植物は、遺伝的形質転換によって得ることができるか、又は、当該除草剤耐性を付与する突然変異を含んでいる植物を選抜することによって得ることができる。

【0097】

50

除草剤抵抗性植物は、例えば、グリホセート耐性植物、即ち、除草剤グリホセート又はその塩に対して耐性にされた植物である。植物は、種々の方法によって、グリホセートに対して耐性にすることができる。例えば、グリホセート耐性植物は、酵素5-エノールピルビルシキミ酸-3-リン酸シンターゼ(EPSPS)をコードする遺伝子で植物を形質転換させることによって得ることができる。そのようなEPSPS遺伝子の例は、以下のものである：細菌サルモネラ・チフィムリウム(*Salmonella typhimurium*)のAroA遺伝子(突然変異CT7)(Comai et al., 1983, *Science* 221, 370-371)、細菌アグロバクテリウム属各種(*Agrobacterium sp.*)のCP4遺伝子(Barry et al., 1992, *Curr. Topics Plant Physiol.* 7, 139-145)、ペチュニアのEPSPSをコードする遺伝子(Shah et al., 1986, *Science* 233, 478-481)、トマトのEPSPSをコードする遺伝子(Gasser et al., 1988, *J. Biol. Chem.* 263, 4280-4289)又はオヒシバ属(*Eleusine*)のEPSPSをコードする遺伝子(WO 01/66704)。それは、例えばEP 0837944、WO 00/66746、WO 00/66747又はWO 02/26995などに記述されているように、突然変異EPSPSであることも可能である。グリホセート耐性植物は、さらにまた、米国特許第5,776,760号及び米国特許第5,463,175号に記述されているように、グリホセートオキシドレダクターゼ酵素をコードする遺伝子を発現させることによって得ることもできる。グリホセート耐性植物は、さらにまた、例えばWO 02/36782、WO 03/092360、WO 05/012515及びWO 07/024782などに記述されているように、グリホセートアセチルトランスフェラーゼ酵素をコードする遺伝子を発現させることによって得ることもできる。グリホセート耐性植物は、さらにまた、例えばWO 01/024615又はWO 03/013226などに記述されているように、上記遺伝子の自然発生突然変異を含んでいる植物を選抜することによって得ることもできる。グリホセート耐性を付与するEPSPS遺伝子を発現する植物は、例えば、米国特許出願第11/517,991号、米国特許出願第10/739,610号、米国特許出願第12/139,408号、米国特許出願第12/352,532号、米国特許出願第11/312,866号、米国特許出願第11/315,678号、米国特許出願第12/421,292号、米国特許出願第11/400,598号、米国特許出願第11/651,752号、米国特許出願第11/681,285号、米国特許出願第11/605,824号、米国特許出願第12/468,205号、米国特許出願第11/760,570号、米国特許出願第11/762,526号、米国特許出願第11/769,327号、米国特許出願第11/769,255号、米国特許出願第11/943801号又は米国特許出願第12/362,774号などに記載されている。グリホセート耐性を付与する別の遺伝子(例えば、デカルボキシラーゼ遺伝子)を含んでいる植物は、例えば、米国特許出願第11/588,811号、米国特許出願第11/185,342号、米国特許出願第12/364,724号、米国特許出願第11/185,560号又は米国特許出願第12/423,926号などに記載されている。

【0098】

別の除草剤抵抗性植物は、例えば、酵素グルタミンシンターゼを阻害する除草剤(例えば、ピアラホス、ホスフィノトリシン又はグルホシネート)に対して耐性にされている植物である。そのような植物は、当該除草剤を解毒する酵素を発現させるか、又は、阻害に対して抵抗性を示す突然変異グルタミンシンターゼ酵素を発現させることによって、得ることができる(例えば、米国特許出願第11/760,602号に記載されている)。そのような有効な一解毒酵素は、ホスフィノトリシンアセチルトランスフェラーゼをコードする酵素である(例えば、ストレプトマイセス属各種(*Streptomyces sp. ecies*)に由来するbartanパク質又はpatanパク質)。外因性のホスフィノトリシンアセチルトランスフェラーゼを発現する植物は、例えば、米国特許第5,561

、236号、米国特許第5,648,477号、米国特許第5,646,024号、米国特許第5,273,894号、米国特許第5,637,489号、米国特許第5,276,268号、米国特許第5,739,082号、米国特許第5,908,810号及び米国特許第7,112,665号などに記述されている。

【0099】

さらなる除草剤耐性植物は、さらにまた、酵素ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ (HPPD) を阻害する除草剤に対して耐性にされている植物である。ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ類は、パラ-ヒドロキシフェニルピルベート (HPP) がホモゲンチセートに変換される反応を触媒する酵素である。HPPD阻害薬に対して耐性を示す植物は、WO 96/38567、WO 99/24585、WO 99/24586、WO 2009/144079、WO 2002/046387又はUS 6,768,044に記述されているように、自然発生抵抗性HPPD酵素をコードする遺伝子を用いて、又は、突然変異HPPD酵素若しくはキメラHPPD酵素をコードする遺伝子を用いて、形質転換させることができる。HPPD阻害薬に対する耐性は、さらにまた、HPPD阻害薬による天然HPPD酵素の阻害にもかかわらずホモゲンチセートを形成させることが可能な特定の酵素をコードする遺伝子を用いて植物を形質転換させることによっても得ることができる。そのような植物及び遺伝子は、WO 99/34008及びWO 02/36787に記述されている。HPPD阻害薬に対する植物の耐性は、さらにまた、WO 2004/024928に記述されているように、HPPD耐性酵素をコードする遺伝子に加えてプレフェナートデスヒドロゲナーゼ (PDH) 活性を有する酵素をコードする遺伝子を用いて植物を形質転換させることによって改善することもできる。さらに、植物は、WO 2007/103567及びWO 2008/150473に記載されているように、そのゲノムの中にHPPD阻害薬を代謝又は分解することが可能な酵素 (例えば、CYP450酵素) をコードする遺伝子を加えることによって、HPPD阻害薬除草剤に対してさらに耐性にすることができる。

10

20

30

40

【0100】

さらに別の除草剤抵抗性植物は、アセトラクテートシンターゼ (ALS) 阻害薬に対して耐性にされている植物である。既知ALS阻害薬としては、例えば、スルホニル尿素系除草剤、イミダゾリノン系除草剤、トリアゾロピリミジン系除草剤、ピリミジニルオキシ (チオ) ベンゾエート系除草剤、及び/又は、スルホニルアミノカルボニルトリアゾリノン系除草剤などがある。ALS酵素 (「アセトヒドロキシ酸シンターゼ (AHAS)」としても知られている) における種々の突然変異体は、例えば「Tranel and Wright (2002, Weed Science 50:700-712)」などに記述され、さらに、米国特許第5,605,011号、米国特許第5,378,824号、米国特許第5,141,870号及び米国特許第5,013,659号などにも記述されているように、種々の除草剤及び除草剤の群に対する耐性を付与することが知られている。スルホニル尿素耐性植物及びイミダゾリノン耐性植物の作製については、米国特許第5,605,011号、米国特許第5,013,659号、米国特許第5,141,870号、米国特許第5,767,361号、米国特許第5,731,180号、米国特許第5,304,732号、米国特許第4,761,373号、米国特許第5,331,107号、米国特許第5,928,937号及び米国特許第5,378,824号並びに国際公開WO 96/33270号に記述されている。別のイミダゾリノン耐性植物についても、例えば、WO 2004/040012、WO 2004/106529、WO 2005/020673、WO 2005/093093、WO 2006/007373、WO 2006/015376、WO 2006/024351及びWO 2006/060634などに記述されている。さらなるスルホニル尿素耐性植物及びイミダゾリノン耐性植物は、さらにまた、例えば、WO 07/024782及び米国特許出願第61/288958号などにも記述されている。

50

【0101】

イミダゾリノン及び/又はスルホニル尿素に対して耐性を示す別の植物は、例えば、ダ

イズに関しては米国特許第5,084,082号に記述されているように、イネに関してはWO 97/41218に記述されているように、テンサイに関しては米国特許第5,773,702号及びWO 99/057965に記述されているように、レタスに関しては米国特許第5,198,599号に記述されているように、又は、ヒマワリに関してはWO 01/065922に記述されているように、誘導された突然変異誘発、当該除草剤の存在下での細胞培養における選抜又は突然変異育種によって得ることができる。

【0102】

本発明に従って同様に処理し得る植物又は植物品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られたもの）は、昆虫抵抗性トランスジェニック植物、即ち、特定の標的昆虫による攻撃に対して抵抗性にされた植物である。そのような植物は、遺伝的形質転換によって得ることができるか、又は、そのような昆虫抵抗性を付与する突然変異を含んでいる植物を選抜することによって得ることができる。

10

【0103】

本明細書中で使用されている場合、「昆虫抵抗性トランスジェニック植物」には、以下のものをコードするコード配列を含んでいる少なくとも1の導入遺伝子を含んでいる任意の植物が包含される：

(1) バシルス・ツリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) に由来する殺虫性結晶タンパク質又はその殺虫活性を示す一部分、例えば、クリックモアら「Crickmore et al. (1998, *Microbiology and Molecular Biology Reviews*, 62:807-813)」によって記載され、クリックモアら「Crickmore et al. (2005)」によって、オンライン「http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/」上で「バシルス・ツリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 毒素命名法」において更新された殺虫性結晶タンパク質又はその殺虫活性を示す一部分、例えば、Cryタンパク質類 (Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1B, Cry1C, Cry1D, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Aa, 又は、Cry3Bb) のタンパク質若しくはその殺虫活性を示す一部分 (例えば、EP 1999141、及び、WO 2007/107302)、又は、例えば米国特許出願第12/249,016に記載されている合成遺伝子によってコードされているタンパク質；又は、

20

30

(2) バシルス・ツリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) に由来する第2の別の結晶タンパク質又はその一部分の存在下において殺虫活性を示す、バシルス・ツリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) に由来する結晶タンパク質又はその一部分、例えば、Cry34結晶タンパク質とCry35結晶タンパク質で構成されているバイナリートキシン (Moellenbeck et al. 2001, *Nat. Biotechnol.* 19:668-72; Schnepf et al. 2006, *Applied Environm. Microbiol.* 71, 1765-1774)、又は、Cry1A若しくはCry1Fタンパク質とCry2Aa若しくはCry2Ab若しくはCry2Aeタンパク質で構成されているバイナリートキシン (米国特許出願第12/214,022号、及び、EP 08010791.5)；又は、

40

(3) バシルス・ツリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) に由来する種々の殺虫性結晶タンパク質の一部分を含んでいる殺虫性ハイブリッドタンパク質、例えば、上記(1)のタンパク質のハイブリッド、又は、上記(2)のタンパク質のハイブリッド、例えば、トウモロコシイベントMON89034で産生されるCry1A.105タンパク質 (WO 2007/027777)；又は、

(4) 上記(1)～(3)のいずれか1つのタンパク質において、標的昆虫種に対するさらに強い殺虫活性を得るために、及び/又は、影響を受ける標的昆虫種の範囲を拡大するために、及び/又は、クローニング若しくは形質転換に際してコード化DNA中に導入された変化に起因して、幾つかのアミノ酸 (特に、1～10のアミノ酸) が別のアミノ

50

酸で置き換えられているもの、例えば、トウモロコシイベントMON863若しくはMON88017におけるCry3Bb1タンパク質又はトウモロコシイベントMIR604におけるCry3Aタンパク質；又は、

(5) バシルス・ツリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 又はバシルス・セレウス (*Bacillus cereus*) に由来する殺虫性分泌タンパク質又はその殺虫活性を示す一部分、例えば、「http://www.life.sci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html」において挙げられている栄養生長期殺虫性タンパク質 (vegetative insecticidal protein) (VIP)、例えば、VIP3Aaタンパク質類のタンパク質；又は、

(6) バシルス・ツリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 又はバシルス・セレウス (*Bacillus cereus*) に由来する第2の分泌タンパク質の存在下において殺虫活性を示す、バシルス・ツリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 又はバシルス・セレウス (*Bacillus cereus*) に由来する分泌タンパク質、例えば、VIP1Aタンパク質とVIP2Aタンパク質で構成されているバイナリートキシン (WO 94/21795)；又は、

(7) バシルス・ツリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 又はバシルス・セレウス (*Bacillus cereus*) に由来する種々の分泌タンパク質の一部分を含んでいる殺虫性ハイブリッドタンパク質、例えば、上記(1)のタンパク質のハイブリッド、又は、上記(2)のタンパク質のハイブリッド；又は、

(8) 上記(5)～(7)のいずれか1つのタンパク質において、標的昆虫種に対するさらに強い殺虫活性を得るために、及び/又は、影響を受ける標的昆虫種の範囲を拡大するために、及び/又は、クローニング若しくは形質転換に際してコード化DNA中に導入された変化(それでも、まだ、殺虫性タンパク質をコードしている)に起因して、幾つかのアミノ酸(特に、1～10のアミノ酸)が別のアミノ酸で置き換えられているもの、例えば、ワタイイベントCOT102におけるVIP3Aaタンパク質；又は、

(9) バシルス・ツリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) に由来する結晶タンパク質の存在下において殺虫活性を示す、バシルス・ツリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 又はバシルス・セレウス (*Bacillus cereus*) に由来する分泌タンパク質、例えば、VIP3とCry1A若しくはCry1Fで構成されているバイナリートキシン(米国特許出願第61/126083号、及び、米国特許出願第61/195019号)、又は、VIP3タンパク質とCry2Aaタンパク質若しくはCry2Abタンパク質若しくはCry2Aeタンパク質で構成されているバイナリートキシン(米国特許出願第12/214,022号、及び、EP 08010791.5)；又は、

(10) 上記(9)のタンパク質において、標的昆虫種に対するさらに強い殺虫活性を得るために、及び/又は、影響を受ける標的昆虫種の範囲を拡大するために、及び/又は、クローニング若しくは形質転換に際してコード化DNA中に導入された変化(それでも、まだ、殺虫性タンパク質をコードしている)に起因して、幾つかのアミノ酸(特に、1～10のアミノ酸)が別のアミノ酸で置き換えられているもの。

【0104】

もちろん、「昆虫抵抗性トランスジェニック植物」は、本明細書中で使用されている場合、上記クラス(1)～(10)のいずれか1つのタンパク質をコードする遺伝子の組合せを含んでいる任意の植物も包含する。一実施形態では、異なった標的昆虫種に対して異なったタンパク質を使用した場合に影響を受ける標的昆虫種の範囲を拡大するために、又は、同一の標的昆虫種に対して殺虫活性を示すが作用機序は異なっている(例えば、当該昆虫体内の異なった受容体結合部位に結合する)異なったタンパク質を用いることによって当該植物に対する昆虫の抵抗性の発達を遅延させるために、昆虫抵抗性植物は、上記クラス(1)～(10)のいずれか1つのタンパク質をコードする2つ以上の導入遺伝子を含んでいる。

10

20

30

40

50

【0105】

「昆虫抵抗性トランスジェニック植物」は、本明細書中で使用されている場合、さらに、例えばWO 2007/080126、WO 2006/129204、WO 2007/074405、WO 2007/080127及びWO 2007/035650などに記述されているような、植物の害虫に摂取されたときにその害虫の成長を阻害する二本鎖RNAを発現時に産生する配列を含んでいる少なくとも1の導入遺伝子を含んでいる任意の植物も包含する。

【0106】

本発明に従って同様に処理し得る植物又は植物品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られたもの）は、非生物的ストレスに対して耐性を示す。そのような植物は、遺伝的形質転換によって得ることができるか、又は、そのようなストレス抵抗性を付与する突然変異を含んでいる植物を選抜することによって得ることができる。特に有用なストレス耐性植物としては、以下のものなどがある：

(1) 植物細胞内又は植物内におけるポリ(ADP-リボース)ポリメラーゼ(PARP)遺伝子の発現及び/又は活性を低減させることが可能な導入遺伝子を含んでいる植物(WO 00/04173、WO /2006/045633、EP 04077984.5又はEP 06009836.5に記述されている)；

(2) 植物又は植物細胞のPARGコード化遺伝子の発現及び/又は活性を低減させることが可能なストレス耐性を強化する導入遺伝子を含んでいる植物(例えば、WO 2004/090140などに記述されている)；

(3) ニコチンアミダーゼ、ニコチン酸ホスホリボシルトランスフェラーゼ、ニコチン酸モノヌクレオチドアデニルトランスフェラーゼ、ニコチンアミドアデニンジヌクレオチドシンターゼ又はニコチンアミドホスホリボシルトランスフェラーゼを包含するニコチンアミドアデニンジヌクレオチドサルベージ合成経路の植物機能性酵素(plant-functional enzyme)をコードするストレス耐性を強化する導入遺伝子を含んでいる植物(例えば、EP 04077624.7、WO 2006/133827、PCT/EP07/002433、EP 1999263又はWO 2007/107326などに記述されている)。

【0107】

本発明に従って同様に処理し得る植物又は植物品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られたもの）は、収穫された生産物の改変された量、品質及び/若しくは貯蔵安定性、並びに/又は、収穫された生産物の特定の成分の改変された特性を示す。例えば：

(1) 野生型の植物細胞又は植物において合成された澱粉と比較して、その物理化学的特性〔特に、アミロース含有量若しくはアミロース/アミロペクチン比、枝分かれ度、平均鎖長、側鎖分布、粘性挙動、ゲル化強度(gelling strength)、澱粉粒径及び/又は澱粉粒子形態〕が変えられていて、特定の用途により適した変性澱粉を合成するトランスジェニック植物。変性澱粉を合成する該トランスジェニック植物は、例えば、EP 0571427、WO 95/04826、EP 0719338、WO 96/15248、WO 96/19581、WO 96/27674、WO 97/11188、WO 97/26362、WO 97/32985、WO 97/42328、WO 97/44472、WO 97/45545、WO 98/27212、WO 98/40503、WO 99/58688、WO 99/58690、WO 99/58654、WO 00/08184、WO 00/08185、WO 00/08175、WO 00/28052、WO 00/77229、WO 01/12782、WO 01/12826、WO 02/101059、WO 03/071860、WO 2004/056999、WO 2005/030942、WO 2005/030941、WO 2005/095632、WO 2005/095617、WO 2005/095619、WO 2005/095618、WO 2005/123927、WO 2006/018319、WO 2006/103107、WO 2006/108702、

10

20

30

40

50

WO 2007/009823、WO 00/22140、WO 2006/06386
 2、WO 2006/072603、WO 02/034923、EP 0609013
 4.5、EP 06090228.5、EP 06090227.7、EP 07090
 007.1、EP 07090009.7、WO 01/14569、WO 02/79
 410、WO 03/33540、WO 2004/078983、WO 01/199
 75、WO 95/26407、WO 96/34968、WO 98/20145、W
 O 99/12950、WO 99/66050、WO 99/53072、US 6,
 734, 341、WO 00/11192、WO 98/22604、WO 98/32
 326、WO 01/98509、WO 01/98509、WO 2005/0023
 59、US 5, 824, 790、US 6, 013, 861、WO 94/04693 10
 、WO 94/09144、WO 94/11520、WO 95/35026、WO
 97/20936に開示されている；

(2) 非澱粉炭水化物ポリマーを合成するか又は遺伝子組換えがなされていない野生
 型植物と比較して改変された特性を有する非澱粉炭水化物ポリマーを合成するトランスジ
 ェニック植物。その例は、ポリフルクトース(特に、イヌリン型及びレバン型のポリフル
 クトース)を産生する植物(EP 0663956、WO 96/01904、WO 9
 6/21023、WO 98/39460及びWO 99/24593に開示されている
)、 - 1, 4 - グルカン類を産生する植物(WO 95/31553、US 2002
 031826、US 6, 284, 479、US 5, 712, 107、WO 97/4
 7806、WO 97/47807、WO 97/47808及びWO 00/1424 20
 9に開示されている)、 - 1, 6 - 分枝 - 1, 4 - グルカン類を産生する植物(W
 O 00/73422に開示されている)、及び、アルテルナンを産生する植物(WO
 00/47727、WO 00/73422、EP 06077301.7、US 5,
 908, 975及びEP 0728213などに開示されている)である；

(3) ヒアルロナンを産生するトランスジェニック植物(例えば、WO 2006/
 032538、WO 2007/039314、WO 2007/039315、WO
 2007/039316、JP 2006304779及びWO 2005/01252
 9などに開示されている)。

【0108】

(4) トランスジェニック植物又はハイブリッド植物、例えば、「可溶性固形物高含 30
 有量」、「低辛味」(LP)及び/又は「長期保存」(LS)などの特性を有するタマネ
 ギ(米国特許出願第12/020,360号及び米国特許出願第61/054,026号
 に記述されている)。

【0109】

本発明に従って同様に処理し得る植物又は植物品種(遺伝子工学などの植物バイオテク
 ノロジー法によって得ることができるものは、改変された繊維特性を有する植物(例え
 ば、ワタ植物)である。そのような植物は、遺伝的形質転換によって得ることができるか、
 又は、そのような改変された繊維特性を付与する突然変異を含んでいる植物を選抜するこ
 とによって得ることができる。そのような植物としては、以下のものなどがある：

(a) 改変された形態のセルロースシンターゼ遺伝子を含んでいる植物(例えば、ワ 40
 タ植物)(WO 98/00549に記述されている)；

(b) 改変された形態のrsw2相同核酸又はrsw3相同核酸を含んでいる植物(例
 えば、ワタ植物)(WO 2004/053219に記述されている)；

(c) スクロースリン酸シンターゼの発現が増大している植物(例えば、ワタ植物)
 (WO 01/17333に記述されている)；

(d) スクロースシンターゼの発現が増大している植物(例えば、ワタ植物)(WO
 02/45485に記述されている)；

(e) 繊維細胞に基づいた原形質連絡のゲーティングのタイミングが(例えば、繊維 50
 選択的 - 1, 3 - グルカナーゼのダウンレギュレーションを介して)改変されている植
 物(例えば、ワタ植物)(WO 2005/017157に記述されているか、又は、E

P 08075514.3若しくは米国特許出願第61/128,938号に記述されている) ;

(f) 反応性が(例えば、nodCを包含するN-アセチルグルコサミントランスフェラーゼ遺伝子の発現及びキチンシンターゼ遺伝子の発現を介して) 改変されている繊維を有する植物(例えば、ワタ植物)(WO 2006/136351に記述されている)。

【0110】

本発明に従って同様に処理し得る植物又は植物品種(遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得ることができるもの)は、改変されたオイルプロファイル特性を有する植物(例えば、ナタネ植物又は関連するアブラナ属植物)である。そのような植物は、10 遺伝的形質転換によって得ることができるか、又は、そのような改変されたオイル特性を付与する突然変異を含んでいる植物を選抜することによって得ることができる。そのような植物としては、以下のものなどがある：

(a) オレイン酸含有量が高いオイルを産生する植物(例えば、ナタネ植物)(例えば、US 5,969,169、US 5,840,946、US 6,323,392又はUS 6,063,947などに記載されている) ;

(b) リノレン酸含有量が低いオイルを産生する植物(例えば、ナタネ植物)(US 6,270,828、US 6,169,190又はUS 5,965,755に記載されている) ;

(c) 飽和脂肪酸のレベルが低いオイルを産生する植物(例えば、ナタネ植物)(例えば、米国特許第5,434,283号又は米国特許出願第12/668303号などに記載されている)。20

【0111】

本発明に従って同様に処理し得る植物又は植物品種(遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得ることができるもの)は、改変された種子脱粒特性を有する植物(例えば、ナタネ植物又は関連するアブラナ属植物)である。そのような植物は、遺伝的形質転換によって得ることができるか、又は、そのような改変された種子脱粒特性を付与する突然変異を含んでいる植物を選抜することによって得ることができる。そのような植物としては、種子の脱粒が遅延されているか又は低減されている植物(例えば、ナタネ植物)などがある(米国特許出願第61/135,230号、WO 09/068313及びWO 10/006732に記述されている)。30

【0112】

本発明に従って処理し得る特に有用なトランスジェニック植物は、アメリカ合衆国内における規制除外(non-regulated status)についてのアメリカ合衆国農務省(USDA)の動植物検疫局(APHIS)に対する申請の対象である(ここで、そのような申請は、許可されているか又は審理中である)、形質転換イベント又は形質転換イベントの組合せを含んでいる植物である。いつ何時でも、この情報は、APHIS(4700 River Road Riverdale, MD 20737, USA)から、例えば、そのインターネットサイト(URL http://www.aphis.usda.gov/brs/not_reg.html)において、容易に入手することができる。本出願の出願日においてAPHISが審理中であるか又はAPHISによって許可された規制除外に対する申請は、下記情報を含んでいる表Bに記載されている申請であった：40

- 申請： 当該申請の識別番号。形質転換イベントについての技術的な記述は、APHISから(例えば、APHISのウェブサイトにおいて、該申請番号を参照することによって)入手可能な個々の申請書類の中に見いだすことができる。それらの記述は、参照によって本明細書中に組み入れる。
- 申請の拡張： 拡張が請求されている、先の申請についての言及。
- 会社： 当該申請を提出している事業体の名称。
- 規制物： 関連する植物種。50

- トランスジェニック表現型： 形質転換イベントによって植物に付与された形質。
- 形質転換イベント又はライン： 規制除外が請求されている1つ又は複数のイベント（場合により、ラインとも称される）の名称。
- A P H I S 文書： A P H I S に請求することが可能な、申請に関して A P H I S に よって刊行されている種々の文書。

【0113】

単一の形質転換イベント又は形質転換イベントの組合せを含んでいる特に有用なさらなる植物は、例えば、国又は地域のさまざまな規制機関によるデータベースに記載されている〔例えば、「http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx」及び「<http://www.agbios.com/database.php>」を参照されたい〕。

10

【0114】

さらに、特に、トランスジェニック植物としては、表C中に挙げられている特許文献のいずれかに記述されているような、栽培学的に中立的な位置又は有益な位置に導入遺伝子を含んでいる植物などがある。

【0115】

表A

【0116】

【表 1】

形質	参 考 文 献		
水の利用効率	WO 2000/073475		
窒素の利用効率	WO 1995/009911	WO 2007/076115	
	WO 1997/030163	WO 2005/103270	
	WO 2007/092704	WO 2002/002776	
改善された光合成	WO 2008/056915	WO 2004/101751	10
線虫抵抗性	WO 1995/020669	WO 2003/033651	
	WO 2001/051627	WO 1999/060141	
	WO 2008/139334	WO 1998/012335	
	WO 2008/095972	WO 1996/030517	
	WO 2006/085966	WO 1993/018170	
低減された莢の裂開	WO 2006/009649	WO 1997/013865	
	WO 2004/113542	WO 1996/030529	
	WO 1999/015680	WO 1994/023043	20
	WO 1999/000502		
アブラムシ抵抗性	WO 2006/125065	WO 2008/067043	
	WO 1997/046080	WO 2004/072109	
スクレロチニア (Sclerotinia) 抵抗性	WO 2006/135717	WO 2005/000007	
	WO 2006/055851	WO 2002/099385	
	WO 2005/090578	WO 2002/061043	
ボトリチス (Botrytis) 抵抗性	WO 2006/046861	WO 2002/085105	
ブレミア (Bremia) 抵抗性	US 20070022496	WO 2004/049786	30
	WO 2000/063432		
エルウィニア (Erwinia) 抵抗性	WO 2004/049786		
クロステロウイルス抵抗性	WO 2007/073167	WO 2002/022836	
	WO 2007/053015		
ストレス耐性 (渇水耐性を包含する)	WO 2010/019838	WO2008/002480	
	WO 2009/049110	WO2005/033318	
トバモウイルス抵抗性	WO 2006/038794		

40

表 B

2010年3月31日現在において、APHISによって許可されているか又は審理中である規制除外の申請

注記： 「Crops No Longer Regulated」の最新のリストを得るためには、「Current Status of Petitions」を参照されたい。このリストは、自動的に更新され、そして、今日までにAPHISによって受理された全ての申請（これは、審理中の申請、取り下げられた申請、又は、認可された申請を含んでいる）を反映している。

略号：

CMV - キュウリモザイクウイルス；

50

C P B - コロラドハムシ ;
P L R V - ジャガイモ葉巻ウイルス ;
P R S V - パパイア輪点ウイルス ;
P V Y - ジャガイモウイルス Y ;
W M V 2 - カボチャモザイクウイルス 2
Z Y M V - ズッキーニ黄斑モザイクウイルス
【 0 1 1 7 】

【表 2】

審理中にある規制除外の申請						
申請者資料						
申請	申請番号の 拡張 ***	会社	規制物	トランスジェニック 表現型	形質転換イベント 又はライン	
10-070-01p		Virginia Tech	ラッカイ	菌核病抵抗性	N70, P39, 及び W171	10
09-349-01p		Dow AgroSciences	ダズ	除草剤耐性	DAS-68416-4	
09-328-01p		Bayer Crop Science	ダズ	除草剤耐性	FG72	
09-233-01p		Dow	トウモロコシ	除草剤耐性	DAS-40278-9	
09-201-01p		Monsanto	ダズ		MON-87705-6	20
09-183-01p		Monsanto	ダズ		MON-87769	
09-082-01p		Monsanto	ダズ	鱗翅目昆虫抵抗性	MON 87701	
09-063-01p		Stine Seed	トウモロコシ	グリホサート耐性	HCEM485	
09-055-01p		Monsanto	トウモロコシ	渇水耐性	MON 87460	
09-015-01p		BASF Plant Science, LLC	ダズ	除草剤耐性	BPS-CV127-9 ダズ	30
08-366-01p		ArborGen	ユウカリ	凍結耐性, 改変された稔性	ARB-FTE1-08	
08-340-01p		Bayer	ワタ	グルシネート耐性, 昆虫抵抗性	T304-40XGHB119	
08-338-01p		Pioneer	トウモロコシ	雄性不稔, 回復された稔性, 視覚マーカー	DP-32138-1	
08-315-01p		Florigene	バラ	改変された花の色	IFD-52401-4 及び IFD-52901-9	
07-253-01p		Syngenta	トウモロコシ	鱗翅目昆虫抵抗性	MIR-162 トウモロコシ	40
07-108-01p		Syngenta	ワタ	鱗翅目昆虫抵抗性	COT67B	
06-354-01p		Pioneer	ダズ	高オレイン酸	DP-305423-1	
05-280-01p		Syngenta	トウモロコシ	耐熱性 α -アミラーゼ	3272	

04-110-01p		Monsanto & Forage Genetics	アルファルファ	グリホセート耐性	J101, J163
03-104-01p		Monsanto & Scotts	クリーピングベントグラス	グリホセート耐性	ASR368
審理中にある規制除外の申請					
申請者資料					
申請	申請番号の 拡張 ***	会社	規制物	トランスジェニック 表現型	形質転換イベント 又はライン
07-152-01p		Pioneer	トウモロコシ	グリホセート及びイミダゾリノン耐性	DP-098140-6
04-337-01p		University of Florida	パパイヤ	パパイヤ輪点ウイルス抵抗性	X17-2
06-332-01p		Bayer CropScience	ワタ	グリホセート耐性	GHB614
06-298-01p		Monsanto	トウモロコシ	ヨーロッパアノメイカ抵抗性	MON 89034
06-271-01p		Pioneer	タイズ	グリホセート及びアセトラクテートシタセ耐性	356043 (DP-356043-5)
06-234-01p	98-329-01p	Bayer CropScience	イネ	ホスフィノリシ耐性	LLRICE601
06-178-01p		Monsanto	タイズ	グリホセート耐性	MON 89788
04-362-01p		Syngenta	トウモロコシ	コンシルトワームに対する保護	MIR604
04-264-01p		ARS	プラム	ウメ輪紋ウイルス抵抗性	C5
04-229-01p		Monsanto	トウモロコシ	高リシ	LY038
04-125-01p		Monsanto	トウモロコシ	コンシルトワーム抵抗性	88017
04-086-01p		Monsanto	ワタ	グリホセート耐性	MON 88913
03-353-01p		Dow	トウモロコシ	コンシルトワーム抵抗性	59122

10

20

30

40

03-323-01p		Monsanto	テンサイ	グリホセート耐性	H7-1	
03-181-01p	00-136-01p	Dow	トウモロコシ	鱗翅目昆虫抵抗性及びホスフィノリシ耐性	TC-6275	
03-155-01p		Syngenta	ワタ	鱗翅目昆虫抵抗性	COT 102	
03-036-01p		Mycogen/Dow	ワタ	鱗翅目昆虫抵抗性	281-24-236	
03-036-02p		Mycogen/Dow	ワタ	鱗翅目昆虫抵抗性	3006-210-23	10
02-042-01p		Aventis	ワタ	ホスフィノリシ耐性	LLCotton25	
01-324-01p	98-216-01p	Monsanto	ナタネ	グリホセート耐性	RT200	
01-206-01p	98-278-01p	Aventis	ナタネ	ホスフィノリシ耐性及び受粉制御	MS1 & RF1/RF2	
01-206-02p	97-205-01p	Aventis	ナタネ	ホスフィノリシ耐性	Topas 19/2	20
01-137-01p		Monsanto	トウモロコシ	コンラートワーム抵抗性	MON 863	
01-121-01p		Vector	タバコ	低減されたニコチン	Vector 21-41	
00-342-01p		Monsanto	ワタ	鱗翅目昆虫抵抗性	ワタイベント 15985	
00-136-01p		Mycogen c/o Dow & Pioneer	トウモロコシ	鱗翅目昆虫抵抗性, ホスフィノリシ耐性	ライン 1507	
00-011-01p	97-099-01p	Monsanto	トウモロコシ	グリホセート耐性	NK603	30
99-173-01p	97-204-01p	Monsanto	ジャガイモ	PLRV及びCPB抵抗性	RBMT22-82	
98-349-01p	95-228-01p	AgrEvo	トウモロコシ	ホスフィノリシ耐性及び雄性不稔	MS6	
98-335-01p		U. of Saskatchewan	アマ	スルホニル尿素系除草剤の土壌残留に対する耐性	CDC Triffid	
98-329-01p		AgrEvo	イネ	ホスフィノリシ耐性	LLRICE06, LLRICE62	
98-278-01p		AgrEvo	ナタネ	ホスフィノリシ耐性及び受粉制御	MS8 & RF3	40
98-238-01p		AgrEvo	タマネギ	ホスフィノリシ耐性	GU262	
98-216-01p		Monsanto	ナタネ	グリホセート耐性	RT73	

98-173-01p		Novartis Seeds & Monsanto	ビート	グリホセート耐性	GTSB77	
98-014-01p	96-068-01p	AgrEvo	ダイズ	ホスフィトリシ耐性	A5547-127	
97-342-01p		Pioneer	トウモロコシ	雄性不稔及びホスフィトリシ耐性	676, 678, 680	
97-339-01p		Monsanto	ジャガイモ	CPB及びPVY抵抗性	RBMT15-101, SEMT15-02, SEMT15-15	
97-336-01p		AgrEvo	ビート	ホスフィトリシ耐性	T-120-7	
97-287-01p		Monsanto	トマト	鱗翅目昆虫抵抗性	5345	
97-265-01p		AgrEvo	トウモロコシ	ホスフィトリシ耐性及びLep. 抵抗性	CBH-351	
97-205-01p		AgrEvo	ナネ	ホスフィトリシ耐性	T45	
97-204-01p		Monsanto	ジャガイモ	CPB及びPLRV抵抗性	RBMT21-129 & RBMT21-350	
97-148-01p		Bejo	キウイナ	雄性不稔	RM3-3, RM3-4, RM3-6	
97-099-01p		Monsanto	トウモロコシ	グリホセート耐性	GA21	
97-013-01p		Calgene	ワタ	プロモキシニル耐性及び鱗翅目昆虫抵抗性	Events 31807 & 31808	
97-008-01p		Du Pont	ダイズ	改変されたオイルプロファイル	G94-1, G94-19, G-168	
96-317-01p		Monsanto	トウモロコシ	グリホセート耐性及びECB抵抗性	MON802	
96-291-01p		DeKalb	トウモロコシ	ヨーロッパアノメカ抵抗性	DBT418	
96-248-01p	92-196-01p	Calgene	トマト	改変された果実熟成	1の追加の FLAVRSVR ライン	
96-068-01p		AgrEvo	ダイズ	ホスフィトリシ耐性	W62, W98, A2704-12, A2704-21, A5547-35	
96-051-01p		Cornell U	パパイヤ	PRSV抵抗性	55-1, 63-1	
96-017-01p	95-093-01p	Monsanto	トウモロコシ	ヨーロッパアノメカ抵抗性	MON809 & MON810	
95-352-01p		Asgrow	カボチャ	CMV, ZYMV, WMV2抵抗性	CZW-3	
95-338-		Monsanto	ジャガイモ	CPB抵抗性	SBT02-5 & -7,	

10

20

30

40

01p					ATBT04-6 &-27, -30, -31, -36
95-324-01p		Agritope	トマト	改変された果実熟成	35 1 N
95-256-01p		Du Pont	ワタ	スルホニル尿素耐性	19-51a
95-228-01p		Plant Genetic Systems	トウモロコシ	雄性不稔	MS3
95-195-01p		Northrup King	トウモロコシ	ヨーロッパアワメカ抵抗性	Bt11
95-179-01p	92-196-01p	Calgene	トマト	改変された果実熟成	2の追加の FLAVRSAVR ライン
95-145-01p		DeKalb	トウモロコシ	ホスフィトリシ耐性	B16
95-093-01p		Monsanto	トウモロコシ	鱗翅目昆虫抵抗性	MON 80100
95-053-01p		Monsanto	トマト	改変された果実熟成	8338
95-045-01p		Monsanto	ワタ	グリホサート耐性	1445, 1698
95-030-01p	92-196-01p	Calgene	トマト	改変された果実熟成	20の追加の FLAVRSAVR ライン
94-357-01p		AgrEvo	トウモロコシ	ホスフィトリシ耐性	T14, T25
94-319-01p		Ciba Seeds	トウモロコシ	鱗翅目昆虫抵抗性	Event 176
94-308-01p		Monsanto	ワタ	鱗翅目昆虫抵抗性	531, 757, 1076
94-290-01p		Zeneca & Petoseed	トマト	低減された果実ポリカク ツロナーゼレベル	B, Da, F
94-257-01p		Monsanto	ジャガイモ	鞘翅目昆虫抵抗性	BT6, BT10, BT12, BT16, BT17, BT18, BT23
94-230-01p	92-196-01p	Calgene	トマト	改変された果実熟成	9の追加の FLAVRSAVR ライン
94-228-01p		DNA Plant Tech	トマト	改変された果実熟成	1345-4
94-227-01p	92-196-01p	Calgene	トマト	改変された果実熟成	Line N73 1436-111
94-090-01p		Calgene	ナタネ	改変されたオイルプロファイル	pCGN3828- 212/86- 18 & 23
93-258-01p		Monsanto	ダイズ	グリホサート耐性	40-3-2

10

20

30

40

93-196-01p		Calgene	ワタ	ブクモキシニル耐性	BXN
92-204-01p		Upjohn	カボチャ	WMV2及びZYMV抵抗性	ZW-20
92-196-01p		Calgene	トマト	改変された果実熟成	FLAVR SAVR

*** 申請番号の拡張： 7CFR 340.6(e) に従い、APHISが規制除外の決定を先に規制が解除された物との類似性に基づいて他の生物にまで拡張することを、請求することができる。この縦の列には、規制が解除された物についての先に許可された申請が挙げられている。

*** 予備 EA： 最終的な決定の前にパブリックコメントに最初に使用可能な環境アセスメント。

10

表 C

【 0 1 1 8 】

【表 3】

植物種	イベント	形質	特許文献	
トウモロコシ	PV-ZMGT32 (NK603)	グリホセート耐性	US 2007-056056	
トウモロコシ	MIR604	昆虫抵抗性 (Cry3a055)	EP 1 737 290	
トウモロコシ	LY038	高リシン含有量	US 7, 157, 281	
トウモロコシ	3272	自己プロセシングトウモロコシ (α -アマラーゼ)	US 2006-230473	10
トウモロコシ	PV-ZMIR13 (MON863)	昆虫抵抗性 (Cry3Bb)	US 2006-095986	
トウモロコシ	DAS-59122-7	昆虫抵抗性 (Cry34Ab1/Cry35Ab1)	US 2006-070139	
トウモロコシ	TC1507	昆虫抵抗性 (Cry1F)	US 7, 435, 807	
トウモロコシ	MON810	昆虫抵抗性 (Cry1Ab)	US 2004-180373	
トウモロコシ	VIP1034	昆虫抵抗性	WO 03/052073	
トウモロコシ	B16	グルホシネート抵抗性	US 2003-126634	20
トウモロコシ	GA21	グリホセート抵抗性	US 6, 040, 497	
トウモロコシ	GG25	グリホセート抵抗性	US 6, 040, 497	
トウモロコシ	GJ11	グリホセート抵抗性	US 6, 040, 497	
トウモロコシ	FI117	グリホセート抵抗性	US 6, 040, 497	
トウモロコシ	GAT-ZM1	グルホシネート耐性	WO 01/51654	
トウモロコシ	MON87460	湯水耐性	WO 2009/111263	30
トウモロコシ	DP-098140-6	グリホセート耐性/A L S阻害薬耐性	WO 2008/112019	
コムギ	Event 1	フザリウム抵抗性 (トリコチエン 3-O-アセチルトランスフェラーゼ)	CA 2561992	
テンサイ	T227-1	グリホセート耐性	US 2004-117870	
テンサイ	H7-1	グリホセート耐性	WO 2004-074492	
ダイズ	MON89788	グリホセート耐性	US 2006-282915	
ダイズ	A2704-12	グルホシネート耐性	WO 2006/108674	40
ダイズ	A5547-35	グルホシネート耐性	WO 2006/108675	
ダイズ	DP-305423-1	高オレイン酸 / A L S阻害薬耐性	WO 2008/054747	
イネ	GAT-OS2	グルホシネート耐性	WO 01/83818	
イネ	GAT-OS3	グルホシネート耐性	US 2008-289060	

イネ	PE-7	昆虫抵抗性 (Cry1Ac)	WO 2008/114282	
ナタネ	MS-B2	雄性不稔性	WO 01/31042	
ナタネ	MS-BN1/RF-BN1	雄性不稔性 / 回復	WO 01/41558	
ナタネ	RT73	グリホセート抵抗性	WO 02/36831	
ワタ	CE43-67B	昆虫抵抗性 (Cry1Ab)	WO 2006/128573	
ワタ	CE46-02A	昆虫抵抗性 (Cry1Ab)	WO 2006/128572	10
ワタ	CE44-69D	昆虫抵抗性 (Cry1Ab)	WO 2006/128571	
ワタ	1143-14A	昆虫抵抗性 (Cry1Ab)	WO 2006/128569	
ワタ	1143-51B	昆虫抵抗性 (Cry1Ab)	WO 2006/128570	
ワタ	T342-142	昆虫抵抗性 (Cry1Ab)	WO 2006/128568	
ワタ	イベント 3006-210-23	昆虫抵抗性 (Cry1Ac)	WO 2005/103266	
ワタ	PV-GHGT07 (1445)	グリホセート耐性	US 2004-148666	20
ワタ	MON88913	グリホセート耐性	WO 2004/072235	
ワタ	EE-GH3	グリホセート耐性	WO 2007/017186	
ワタ	T304-40	昆虫抵抗性 (Cry1Ab)	WO2008/122406	
ワタ	Cot202	昆虫抵抗性 (VIP3)	US 2007-067868	
ワタ	LLcotton25	グルホシネート抵抗性	WO 2007/017186	
ワタ	EE-GH5	昆虫抵抗性 (Cry1Ab)	WO 2008/122406	
ワタ	イベント 281-24-236	昆虫抵抗性 (Cry1F)	WO 2005/103266	30
ワタ	Cot102	昆虫抵抗性 (Vip3A)	US 2006-130175	
ワタ	MON 15985	昆虫抵抗性 (Cry1A/Cry2Ab)	US 2004-250317	
ベントグラス	Asr-368	グリホセート耐性	US 2006-162007	
ナス	EE-1	昆虫抵抗性 (Cry1Ac)	WO 2007/091277	

本発明の方法で防除することが可能な植物又は作物の病害の中で、以下のものを挙げる
ことができる：

- ・ うどんこ病 (powdery mildew disease)、例えば、ブルメリア (Blumeria) 病、例えば、ブルメリア・グラミニス (Blumeria graminis) に起因するもの；
- ポドスファエラ (Podosphaera) 病、例えば、ポドスファエラ・レウコトリカ (Podosphaera leucotricha) に起因するもの；
- スファエロテカ (Sphaerotheca) 病、例えば、スファエロテカ・フリギネア (Sphaerotheca fuliginea) に起因するもの；
- ウンシヌラ (Uncinula) 病、例えば、ウンシヌラ・ネカトル (Uncinula necator) に起因するもの；

- ・ さび病 (rust disease)、例えば、

40

50

ギムノスポランギウム (*Gymnosporangium*) 病、例えば、ギムノスポランギウム・サピナエ (*Gymnosporangium sabiniae*) に起因するもの；

ヘミレイア (*Hemileia*) 病、例えば、ヘミレイア・バスタトリクス (*Hemileia vastatrix*) に起因するもの；

ファコプソラ (*Phakopsora*) 病、例えば、ファコプソラ・パキリジ (*Phakopsora pachyrhizi*) 又はファコプソラ・メイボミアエ (*Phakopsora meibomiae*) に起因するもの；

プッシニア (*Puccinia*) 病、例えば、プッシニア・レコンジテ (*Puccinia recondite*)、プッシニア・グラミニス (*Puccinia graminis*) 又はプッシニア・ストリイホルミス (*Puccinia striiformis*) に起因するもの；

ウロミセス (*Uromyces*) 病、例えば、ウロミセス・アペンジクラツス (*Uromyces appendiculatus*) に起因するもの；

・ 卵菌類による病害 (*Oomycete disease*)、例えば、

アルブゴ (*Albugo*) 病、例えば、アルブゴ・カンジダ (*Albugo candida*) に起因するもの；

ブレミア (*Bremia*) 病、例えば、ブレミア・ラクツカエ (*Bremia lactucae*) に起因するもの；

ペロノスポラ (*Peronospora*) 病、例えば、ペロノスポラ・ピシ (*Peronospora pisi*) 又はペロノスポラ・ブラシカエ (*P. brassicae*) に起因するもの；

フィトフトラ (*Phytophthora*) 病、例えば、フィトフトラ・インフェスタンス (*Phytophthora infestans*) に起因するもの；

プラスモパラ (*Plasmopara*) 病、例えば、プラスモパラ・ビチコラ (*Plasmopara viticola*) に起因するもの；

プセウドペロノスポラ (*Pseudoperonospora*) 病、例えば、プセウドペロノスポラ・フムリ (*Pseudoperonospora humuli*) 又はプセウドペロノスポラ・クベンシス (*Pseudoperonospora cubensis*) に起因するもの；

ピシウム (*Pythium*) 病、例えば、ピシウム・ウルチムム (*Pythium ultimum*) に起因するもの；

・ 葉斑点性、葉汚斑性及び葉枯れ性の病害 (*leaf spot, leaf blotch and leaf blight disease*)、例えば、

アルテルナリア (*Alternaria*) 病、例えば、アルテルナリア・ソラニ (*Alternaria solani*) に起因するもの；

セルコスポラ (*Cercospora*) 病、例えば、セルコスポラ・ベチコラ (*Cercospora beticola*) に起因するもの；

クラジオスポルム (*Cladiosporium*) 病、例えば、クラジオスポリウム・ククメリヌム (*Cladiosporium cucumerinum*) に起因するもの；

コクリオボルス (*Cochliobolus*) 病、例えば、コクリオボルス・サチブス (*Cochliobolus sativus*) (分生子形態: *Drechslera*、異名: *Helminthosporium*) 又はコクリオボルス・ミヤベアヌス (*Cochliobolus miyabeanus*) に起因するもの；

コレトトリクム (*Colletotrichum*) 病、例えば、コレトトリクム・リンデムタニウム (*Colletotrichum lindemuthanium*) に起因するもの；

シクロコニウム (*Cycloconium*) 病、例えば、シクロコニウム・オレアギヌム (*Cycloconium oleagineum*) に起因するもの；

ジアポルテ (*Diaporthe*) 病、例えば、ジアポルテ・シトリ (*Diaporthe*

10

20

30

40

50

he citri) に起因するもの；

エルシノエ (Elsinoe) 病、例えば、エルシノエ・ファウセッチイ (Elsinoe fawcettii) に起因するもの；

グロエオスポリウム (Gloeosporium) 病、例えば、グロエオスポリウム・ラエチコロール (Gloeosporium laeticolor) に起因するもの；

グロメレラ (Glomerella) 病、例えば、グロメレラ・シングラタ (Glomerella cingulata) に起因するもの；

グイグナルジア (Guignardia) 病、例えば、グイグナルジア・ビドウェリ (Guignardia bidwellii) に起因するもの；

レプトスファエリア (Leptosphaeria) 病、例えば、レプトスファエリア・マクランズ (Leptosphaeria maculans)、レプトスファエリア・ノドルム (Leptosphaeria nodorum) に起因するもの；

マグナポルテ (Magnaporthe) 病、例えば、マグナポルテ・グリセア (Magnaporthe grisea) に起因するもの；

ミコスファエレラ (Mycosphaerella) 病、例えば、ミコスファエレラ・グラミニコラ (Mycosphaerella graminicola)、ミコスファエレラ・アラキジコラ (Mycosphaerella arachidicola)、ミコスファエレラ・フィジエンシス (Mycosphaerella fijiensis) に起因するもの；

ファエオスファエリア (Phaeosphaeria) 病、例えば、ファエオスファエリア・ノドルム (Phaeosphaeria nodorum) に起因するもの；

ピレノホラ (Pyrenophora) 病、例えば、ピレノホラ・テレス (Pyrenophora teres) 又はピレノホラ・トリチシ・レペンチス (Pyrenophora tritici repentis) に起因するもの；

ラムラリア (Ramularia) 病、例えば、ラムラリア・コロ・シグニ (Ramularia collo-cygni) 又はラムラリア・アレオラ (Ramularia areola) に起因するもの；

リンコスポリウム (Rhynchosporium) 病、例えば、リンコスポリウム・セカリス (Rhynchosporium secalis) に起因するもの；

セプトリア (Septoria) 病、例えば、セプトリア・アピイ (Septoria apii) 又はセプトリア・リコベルシシ (Septoria lycopersici) に起因するもの；

チフラ (Typhula) 病、例えば、チフラ・インカルナタ (Typhula incarnata) に起因するもの；

ベンツリア (Venturia) 病、例えば、ベンツリア・イナエクアリス (Venturia inaequalis) に起因するもの；

・ 根、葉鞘及び茎の病害 (root, sheath and stem disease)、例えば、

コルチシウム (Corticium) 病、例えば、コルチシウム・グラミネアルム (Corticium graminearum) に起因するもの；

フサリウム (Fusarium) 病、例えば、フサリウム・オキシスポルム (Fusarium oxysporum) に起因するもの；

ガエウマンノミセス (Gaeumannomyces) 病、例えば、ガエウマンノミセス・グラミニス (Gaeumannomyces graminis) に起因するもの；

リゾクトニア (Rhizoctonia) 病、例えば、リゾクトニア・ソラニ (Rhizoctonia solani) に起因するもの；

サロクラジウム (Sarocladium) 病、例えば、サロクラジウム・オリザエ (Sarocladium oryzae) に起因するもの；

スクレロチウム (Sclerotium) 病、例えば、スクレロチウム・オリザエ (Sclerotium oryzae) に起因するもの；

10

20

30

40

50

- タペシア (*Tapesia*) 病、例えば、タペシア・アクホルミス (*Tapesia aciformis*) に起因するもの；
- チエラビオプシス (*Thielaviopsis*) 病、例えば、チエラビオプシス・バシコラ (*Thielaviopsis basicola*) に起因するもの；
- ・ 穂の病害 (*ear and panicle disease*)、例えば、アルテルナリア (*Alternaria*) 病、例えば、アルテルナリア属種 (*Alternaria spp.*) に起因するもの；
 - アスペルギルス (*Aspergillus*) 病、例えば、アスペルギルス・フラブス (*Aspergillus flavus*) に起因するもの；
 - クラドスポリウム (*Cladosporium*) 病、例えば、クラドスポリウム属種 (*Cladosporium spp.*) に起因するもの；
 - クラビセプス (*Claviceps*) 病、例えば、クラビセプス・ブルブレア (*Claviceps purpurea*) に起因するもの；
 - フサリウム (*Fusarium*) 病、例えば、フサリウム・クルモルム (*Fusarium culmorum*) に起因するもの；
 - ジベレラ (*Gibberella*) 病、例えば、ジベレラ・ゼアエ (*Gibberella zeae*) に起因するもの；
 - モノグラフェラ (*Monographella*) 病、例えば、モノグラフェラ・ニバリス (*Monographella nivalis*) に起因するもの；
 - ・ 黒穂病 (*smut and bunt disease*)、例えば、スファセロテカ (*Sphacelotheca*) 病、例えば、スファセロテカ・レイリアナ (*Sphacelotheca reiliana*) に起因するもの；
 - チレチア (*Tilletia*) 病、例えば、チレチア・カリエス (*Tilletia caries*) に起因するもの；
 - ウロシスチス (*Urocystis*) 病、例えば、ウロシスチス・オクルタ (*Urocystis occulta*) に起因するもの；
 - ウスチラゴ (*Ustilago*) 病、例えば、ウスチラゴ・ヌダ (*Ustilago nuda*) に起因するもの；
 - ・ 果実の腐敗性及び黴性の病害 (*fruit rot and mould disease*)、例えば、アスペルギルス (*Aspergillus*) 病、例えば、アスペルギルス・フラブス (*Aspergillus flavus*) に起因するもの；
 - ボトリチス (*Botrytis*) 病、例えば、ボトリチス・シネレア (*Botrytis cinerea*) に起因するもの；
 - ペニシリウム (*Penicillium*) 病、例えば、ペニシリウム・エキスパンスム (*Penicillium expansum*) に起因するもの；
 - リゾプス (*Rhizopus*) 病、例えば、リゾプス・ストロニフェル (*Rhizopus stolonifer*) に起因するもの；
 - スクレロチニア (*Sclerotinia*) 病、例えば、スクレロチニア・スクレロチオルム (*Sclerotinia sclerotiorum*) に起因するもの；
 - ベルチシリウム (*Verticillium*) 病、例えば、ベルチシリウム・アルボアトルム (*Verticillium albo-atrum*) に起因するもの；
 - ・ 種子及び土壌が媒介する腐朽性、黴性、萎凋性、腐敗性及び苗立ち枯れ性の病害 (*seed and soilborne decay, mould, wilt, rot and damping-off disease*)、アルテルナリア (*Alternaria*) 病、例えば、アルテルナリア・ブラシシコラ (*Alternaria brassicicola*) に起因するもの；
 - アフアノミセス (*Aphanomyces*) 病、例えば、アフアノミセス・エウテイケス (*Aphanomyces euteiches*) に起因するもの；
 - アスコキタ (*Ascochyta*) 病、例えば、アスコキタ・レンチス (*Ascochyta*)

ytalensis)に起因するもの；

アスペルギルス(Aspergillus)病、例えば、アスペルギルス・フラブス(Aspergillus flavus)に起因するもの；

クラドスポリウム(Cladosporium)病、例えば、クラドスポリウム・ヘルバルム(Cladosporium herbarum)に起因するもの；

コクリオボルス(Cochliobolus)病、例えば、コクリオボルス・サチブス(Cochliobolus sativus)(分生子形態：Drechslera、Bipolaris 異名：Helminthosporium)に起因するもの；

コレトトリクム(Colletotrichum)病、例えば、コレトトリクム・ココデス(Colletotrichum coccodes)に起因するもの；

フサリウム(Fusarium)病、例えば、フサリウム・クルモルム(Fusarium culmorum)に起因するもの；

ジベレラ(Gibberella)病、例えば、ジベレラ・ゼアエ(Gibberella zeae)に起因するもの；

マクロホミナ(Macrophomina)病、例えば、マクロホミナ・ファセオリナ(Macrophomina phaseolina)に起因するもの；

モノグラフェラ(Monographella)病、例えば、モノグラフェラ・ニバリス(Monographella nivalis)に起因するもの；

ペニシリウム(Penicillium)病、例えば、ペニシリウム・エキスパンスム(Penicillium expansum)に起因するもの；

ホマ(Phoma)病、例えば、ホマ・リングム(Phoma lingam)に起因するもの；

ホモプシス(Phomopsis)病、例えば、ホモプシス・ソジャエ(Phomopsis sojae)に起因するもの；

フィトフトラ(Phytophthora)病、例えば、フィトフトラ・カクトルム(Phytophthora cactorum)に起因するもの；

ピレノホラ(Pyrenophora)病、例えば、ピレノホラ・グラミネア(Pyrenophora graminea)に起因するもの；

ピリクラリア(Pyricularia)病、例えば、ピリクラリア・オリザエ(Pyricularia oryzae)に起因するもの；

ピシウム(Pythium)病、例えば、ピシウム・ウルチムム(Pythium ultimum)に起因するもの；

リゾクトニア(Rhizoctonia)病、例えば、リゾクトニア・ソラニ(Rhizoctonia solani)に起因するもの；

リゾプス(Rhizopus)病、例えば、リゾプス・オリザエ(Rhizopus oryzae)に起因するもの；

スクレロチウム(Sclerotium)病、例えば、スクレロチウム・ロルフシイ(Sclerotium rolfsii)に起因するもの；

セプトリア(Septoria)病、例えば、セプトリア・ノドルム(Septoria nodorum)に起因するもの；

チフラ(Typhula)病、例えば、チフラ・インカルナタ(Typhula incarnata)に起因するもの；

ベルチシリウム(Verticillium)病、例えば、ベルチシリウム・ダーリアエ(Verticillium dahliae)に起因するもの；

・ 腐乱性病害、開花病及び枯れ込み性病害(canker, broom and dieback disease)、例えば、

ネクトリア(Nectria)病、例えば、ネクトリア・ガリゲナ(Nectria galligena)に起因するもの；

・ 枯損性病害(blight disease)、例えば、

モニリニア(Monilinia)病、例えば、モニリニア・ラキサ(Monilinia

10

20

30

40

50

ia laxa) に起因するもの；

- ・ 葉水泡性病害又は縮葉病 (leaf blister or leaf curl disease)、例えば、

エキソバシジウム (Exobasidium) 病、例えば、エキソバシジウム・ベキサンス (Exobasidium vexans) に起因するもの；

タフリナ (Taphrina) 病、例えば、タフリナ・デホルマンズ (Taphrina deformans) に起因するもの；

- ・ 木本植物の衰退性病害 (decline disease of wooden plant)、例えば、

エスカ (Esca) 病、例えば、ファエオモニエラ・クラミドスポラ (Phaeo-monniella clamydospora) に起因するもの；

ユーティパダイバック病 (Eutypa dieback)、例えば、ユーティパ・ラタ (Eutypa lata) に起因するもの；

ガノデルマ (Ganoderma) 病、例えば、ガノデルマ・ボニネンセ (Ganoderma boninense) に起因するもの；

リギドポルス (Rigidoporus) 病、例えば、リギドポルス・リグノスス (Rigidoporus lignosus) に起因するもの；

- ・ 花及び種子の病害、例えば、

ボトリチス (Botrytis) 病、例えば、ボトリチス・シネレア (Botrytis cinerea) に起因するもの；

- ・ 塊茎の病害、例えば、

リゾクトニア (Rhizoctonia) 病、例えば、リゾクトニア・ソラニ (Rhizoctonia solani) に起因するもの；

ヘルミントスポリウム (Helminthosporium) 病、例えば、ヘルミントスポリウム・ソラニ (Helminthosporium solani) に起因するもの；

- ・ 根瘤病 (club root diseases)、例えば、

プラスモジオホラ (Plasmodiophora) 病、例えば、プラスモジオホラ・ブラシカエ (Plasmodiophora brassicae) に起因するもの；

- ・ 例えば以下のものなどの細菌性微生物に起因する病害；

キサントモナス属各種 (Xanthomonas species)、例えば、キサントモナス・カムペストリス pv. オリザエ (Xanthomonas campestris pv. oryzae)；

シュードモナス属各種 (Pseudomonas species)、例えば、シュードモナス・シリングアエ pv. ラクリマンズ (Pseudomonas syringae pv. lachrymans)；

エルウィニア属各種 (Erwinia species)、例えば、エルウィニア・アミロボラ (Erwinia amylovora)。

【0119】

本発明の組成物は、材木の表面又は内部で発生するであろう菌類病に対しても使用することができる。用語「材木 (timber)」は、全ての種類の木材、そのような木材を建築用に加工した全てのタイプのもの、例えば、ソリッドウッド、高密度木材、積層木材及び合板などを意味する。本発明による材木の処理方法は、主に、本発明の1種類以上の化合物又は本発明の組成物を接触させることにより行う。これには、例えば、直接的な塗布、噴霧、浸漬、注入、又は、別の適切な任意の方法が包含される。

【0120】

本発明の処理方法において通常施用される活性化合物の薬量は、茎葉処理における施用では、一般に、また、有利には、10～800g/ha、好ましくは、50～300g/haである。種子処理の場合は、施用する活性物質の薬量は、一般に、また、有利には、種子100kg当たり2～200g、好ましくは、種子100kg当たり3～150gで

10

20

30

40

50

ある。

【0121】

本明細書中で示されている薬量が本発明の方法を例証するための例として挙げられているということは、明確に理解される。当業者は、特に処理対象の植物又は作物の種類に応じて、該施用薬量を適合させる方法を理解するであろう。

【0122】

本発明の化合物又は混合物は、さらにまた、例えば、真菌症、皮膚病、白癬菌性疾患 (trichophyton disease) 及びカンジダ症、又は、アスペルギルス属種 (Aspergillus spp.) (例えば、アスペルギルス・フミガツス (Aspergillus fumigatus)) に起因する疾患のような、ヒト又は動物の菌類病を治療的又は予防的に処置するのに有用な組成物を調製するのに使用することもできる。

10

【0123】

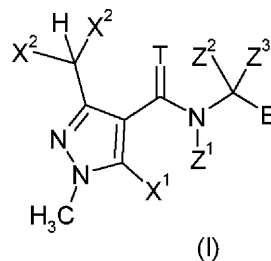
化合物例についての下記表及び調製又は効力についての下記実施例を参照して、本発明のさまざまな態様について説明する。

【0124】

表1は、本発明による式(I)：

【0125】

【化10】



20

で表される化合物の例について非限定的に例証している。

【0126】

表1において、「M+H」(「ApCI+」)は、ポジティブ大気圧化学イオン化法による質量分析において観察された分子イオンピークプラス1 a.m.u. (原子質量単位)を意味する。

30

【0127】

表1において、log P値は、「EEC Directive 79/831 Annex V.A8」に従い、下記に記載されている方法を用いて、逆相カラム(C18)でのHPLC(高性能液体クロマトグラフィー)により測定した：

温度： 40 ；

移動相： 0.1%水性ギ酸及びアセトニトリル；10%アセトニトリルから90%アセトニトリルまでの直線勾配。

40

【0128】

較正は、log P値が知られている非分枝鎖アルカン-2-オン(3個~16個の炭素原子含有)を用いて実施した(log P値は、連続する2種類のアルカノンの間の線形補間を用いて、保持時間をにより測定)。ラムダマックス値は、200nm~400nmの紫外線スペクトル及びクロマトグラフシグナルのピーク値を用いて決定した。

【0129】

表1：

【0130】

【表 4】

実施例	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	質量 (M+H)
1	F	F	O	メチル	H	H	2-フリル	1.87	288
2	Cl	F	O	1-シクロプロピル エチル	H	H	2-フリル	2.98	358
3	F	F	O	1-シクロプロピル エチル	H	H	2-フリル	2.82	342
4	Cl	F	O	シクロプロピル	H	H	2-フリル	2.45	330
5	F	F	O	シクロプロピル	H	H	2-フリル	2.32	314
6	Cl	F	O	メチル	H	H	2-フリル	2.02	304
7	Cl	F	O	シクロヘキシル	H	H	2-フリル	3.35	372
8	F	F	O	シクロヘキシル	H	H	2-フリル	3.21	356
9	Cl	F	O	H	H	H	2-フリル	1.86	290
10	F	F	O	H	H	H	2-フリル	1.66	274
11	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		2-フリル	2.86	344
12	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		2-フリル	2.70	328
13	Cl	F	O	2,2,2- トリフルオロエチル	H	H	ピリジン-3-イル	1.37	383
14	F	F	O	2,2,2- トリフルオロエチル	H	H	ピリジン-3-イル	1.20	367
15	Cl	F	O	シクロヘプチル	H	H	ピリジン-3-イル	1.76	397
16	F	F	O	シクロヘプチル	H	H	ピリジン-3-イル	1.66	381
17	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		ピリジン-3-イル	0.96	355
18	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		ピリジン-3-イル	0.84	339

10

20

30

40

実施例	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	質量 (M+H)
19	Cl	F	O	メチル	i-Pr ⁽¹⁾	H	ピリジン-5-イル	1.76	358
20	F	F	O	メチル	i-Pr	H	ピリジン-5-イル	1.65	342
21	Cl	F	O	メチル	H	H	3-メチル-2-フリル	2.32	318
22	F	F	O	メチル	H	H	3-メチル-2-フリル	2.18	302
23	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		2-メチル-3-フリル	3.11	358
24	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		2-メチル-3-フリル	2.92	342
25	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル	1.93	358
26	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル	2.25	342
27	Cl	F	O	エチル	H	H	4-メチル-1,2,5-オキサジアゾール-3-イル	2.20	334
28	F	F	O	エチル	H	H	4-メチル-1,2,5-オキサジアゾール-3-イル	2.05	318
29	Cl	F	O	プロピル	H	H	2-チエンル	2.90	348
30	F	F	O	プロピル	H	H	2-チエンル	2.77	332
31	Cl	F	O	シクロプロピル	H	H	2-チエンル	2.73	346
32	F	F	O	シクロプロピル	H	H	2-チエンル	2.59	330
33	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		2-チエンル	3.13	360
34	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		2-チエンル	2.96	344
35	F	F	O	シクロプロピル	Me ⁽¹⁾	H	2,5-ジメチル-3-フリル	3.21	356
36	Cl	F	O	シクロプロピル	Me	H	2,5-ジメチル-3-フリル	3.37	372

10

20

30

40

実施例	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	質量 (M+H)
37	Cl	F	O	シクロヘンチル	H	H	3-メチル-2-チエニル	3.61	388
38	F	F	O	シクロヘンチル	H	H	3-メチル-2-チエニル	3.46	372
39	Cl	F	O	シクロプロピル	H	H	3-メチル-2-チエニル	3.02	360
40	F	F	O	シクロプロピル	H	H	3-メチル-2-チエニル	2.88	344
41	Cl	F	O	メチル	H	H	3-メチル-2-チエニル	2.58	334
42	F	F	O	メチル	H	H	3-メチル-2-チエニル	2.44	318
43	Cl	F	O	アリル	H	H	2-メチル-1,3-チアゾール-4-イル	2.20	361
44	F	F	O	アリル	H	H	2-メチル-1,3-チアゾール-4-イル	2.07	345
45	F	F	O	エチル	H	H	1-エチル-3-メチル-1H-ピラゾール-4-イル	1.69	344
46	Cl	F	O	エチル	H	H	1-エチル-3-メチル-1H-ピラゾール-4-イル	1.79	360
47	F	F	O	H	H	H	1-エチル-3-メチル-1H-ピラゾール-4-イル	1.31	316
48	F	F	O	シクロプロピル	Me	H	2,5-ジメチル-3-チエニル	3.62	372
49	Cl	F	O	シクロプロピル	Me	H	2,5-ジメチル-3-チエニル	3.79	388
50	F	F	O	シクロプロピル	Me	H	2-クロロピリジン-3-イル	2.23	373
51	Cl	F	O	メチル	H	H	2-クロロピリジン-3-イル	1.87	349
52	F	F	O	メチル	H	H	2-クロロピリジン-3-イル	1.72	333
53	Cl	F	O	メチル	H	H	2-クロロピリジン-4-イル	1.91	349
54	F	F	O	メチル	H	H	2-クロロピリジン-4-イル	1.76	333

10

20

30

40

実施例	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	質量 (M+H)
55	Cl	F	O	メチル	H	H	5-クロロビ ^o リジン-3-イル	1.90	349
56	F	F	O	メチル	H	H	5-クロロビ ^o リジン-3-イル	1.76	333
57	F	F	O	シクロヘ ⁿ チル	H	H	6-クロロビ ^o リジン-3-イル	2.80	387
58	Cl	F	O	2-メトキシエチル	H	H	6-クロロビ ^o リジン-3-イル	2.15	393
59	F	F	O	2-メトキシエチル	H	H	6-クロロビ ^o リジン-3-イル	2.02	377
60	Cl	F	O	エチル	H	H	6-クロロビ ^o リジン-3-イル	2.23	363
61	F	F	O	エチル	H	H	6-クロロビ ^o リジン-3-イル	2.10	347
62	Cl	F	O	メチル	H	H	6-クロロビ ^o リジン-3-イル	1.98	349
63	F	F	O	メチル	H	H	6-クロロビ ^o リジン-3-イル	1.84	333
64	Cl	F	O	イソプロピ ^o ル	H	H	6-クロロビ ^o リジン-3-イル	2.49	377
65	F	F	O	イソプロピ ^o ル	H	H	6-クロロビ ^o リジン-3-イル	2.33	361
66	Cl	F	O	シクロプロピ ^o ル	H	H	6-クロロビ ^o リジン-3-イル	2.39	375
67	F	F	O	シクロプロピ ^o ル	H	H	6-クロロビ ^o リジン-3-イル	2.25	359
68	Cl	F	O	シクロヘ ⁿ チル	H	H	6-クロロビ ^o リジン-3-イル	2.94	403
69	Cl	F	O	H	H	H	6-クロロビ ^o リジン-3-イル	1.82	335
70	F	F	O	シクロプロピ ^o ル	Me	H	1-ベンゾ ^o フラン-2-イル	3.42	378
71	F	F	O	シクロプロピ ^o ル	H	H	1-ベンゾ ^o フラン-2-イル	3.11	364
72	Cl	F	O	シクロプロピ ^o ル	H	H	1-ベンゾ ^o フラン-2-イル	3.21	380

10

20

30

40

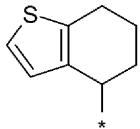
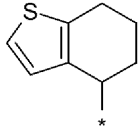
実施例	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	質量 (M+H)
73	F	F	S	シクロプロピル	H	H	1-ベンゾフラン-2-イル	3.76	380
74	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		1-ベンゾフラン-2-イル	3.70	394
75	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		1-ベンゾフラン-2-イル	3.52	378
76	F	F	O	エチル	H	H	2-クロロ-1,3-チアゾール-5-イル	2.21	353
77	Cl	F	O	エチル	H	H	2-クロロ-1,3-チアゾール-5-イル	2.35	369
78	Cl	F	O	エチル	H	H	1-エチル-3,5-ジメチル-1H-ピラゾール-4-イル	1.82	374
79	F	F	O	エチル	H	H	1-エチル-3,5-ジメチル-1H-ピラゾール-4-イル	1.72	358
80	F	F	O	シクロプロピル	Me	H	1-ベンゾチオフェン-2-イル	3.69	394
81	Cl	F	O	H	Me	H	1-ベンゾチオフェン-2-イル	3.13	370
82	F	F	O	H	Me	H	1-ベンゾチオフェン-2-イル	2.98	354
83	Cl	F	O	H	H	H	1-ベンゾチオフェン-2-イル	2.92	356
84	F	F	O	H	H	H	1-ベンゾチオフェン-2-イル	2.75	340
85	F	F	O	シクロプロピル	Me	H	1-ベンゾチオフェン-3-イル	3.60	394
86	F	F	S	シクロプロピル	Me	H	1-ベンゾチオフェン-3-イル	4.44	410
87	Cl	F	O	H	H	H	1-ベンゾチオフェン-3-イル	2.90	356
88	F	F	O	H	H	H	1-ベンゾチオフェン-3-イル	2.73	340
89	Cl	F	O	シクロプロピル	H	H	1-ベンゾチオフェン-3-イル	3.41	396
90	F	F	O	シクロプロピル	H	H	1-ベンゾチオフェン-3-イル	3.27	380

10

20

30

40

実施例	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	質量 (M+H)
91	F	F	O	シクロプロピル	Me	H	1-ベンゾチオフェン-7-イル	3.44	394
92	Cl	F	O	シクロプロピル	Me	H	1-ベンゾチオフェン-7-イル	3.61	410
93	F	F	O	シクロプロピル	H	H	1-ベンゾチオフェン-7-イル	3.19	380
94	Cl	F	O	シクロプロピル	H	H	1-ベンゾチオフェン-7-イル	3.31	396
95	F	F	S	シクロプロピル	H	H	1-ベンゾチオフェン-7-イル	3.83	396
96	F	F	S	シクロプロピル	H	H	1-ベンゾチオフェン-7-イル	4.16	410
97	Cl	F	O	シクロプロピル	H	H	1,3-ベンゾチアゾール-2-イル	2.80	397
98	F	F	O	シクロプロピル	H	H	1,3-ベンゾチアゾール-2-イル	2.68	381
99	Cl	F	O	メチル	H	H	2,1,3-ベンゾチアジアゾール-5-イル	2.32	372
100	F	F	O	メチル	H	H	2,1,3-ベンゾチアジアゾール-5-イル	2.17	356
101	Cl	F	O	メチル	H	H	6-イソプロボキシピリジン-3-イル	2.59	373
102	F	F	O	メチル	H	H	6-イソプロボキシピリジン-3-イル	2.45	357
103	Cl	F	O	H			2.90	346	
104	F	F	O	H			2.73	330	
105	F	F	O	メチル	H	H	3-(2,2-ジメチルプロピル)-1,2-オキサゾール-5-イル	2.75	359
106	F	F	O	シクロプロピル	H	H	3-(2,2-ジメチルプロピル)-1,2-オキサゾール-5-イル	3.17	385
107	Cl	F	O	シクロプロピル	H	H	3-(2,2-ジメチルプロピル)-1,2-オキサゾール-5-イル	3.31	401

10

20

30

40

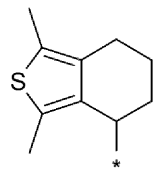
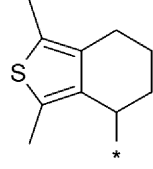
実施例	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	質量 (M+H)
108	Cl	F	O	メチル	H	H	1-フェニル-1H-ピラゾール-4-イル	2.40	380
109	F	F	O	メチル	H	H	1-フェニル-1H-ピラゾール-4-イル	2.26	364
110	F	F	O	メチル	H	H	3-フェニル-1,2-オキサゾール-5-イル	2.51	365
111	F	F	O	シクロプロピル	H	H	3-フェニル-1,2-オキサゾール-5-イル	2.92	391
112	Cl	F	O	シクロプロピル	H	H	3-フェニル-1,2-オキサゾール-5-イル	3.04	407
113	Cl	F	O	メチル	H	H	3-フェニル-1,2,4-オキサジアジアール-5-イル	2.71	382
114	F	F	O	メチル	H	H	3-フェニル-1,2,4-オキサジアジアール-5-イル	2.58	366
115	F	F	O	シクロプロピル	H	H	3,5-ジクロピリジン-4-イル	2.54	393
116	Cl	F	O	シクロプロピル	H	H	3,5-ジクロピリジン-4-イル	2.64	409
117	F	F	S	シクロプロピル	H	H	3,5-ジクロピリジン-4-イル	3.29	409
118	F	F	O	シクロプロピル	H	H	4,6-ジクロピリジン-3-イル	2.73	393
119	Cl	F	O	シクロプロピル	H	H	4,6-ジクロピリジン-3-イル	2.90	409
120	Cl	F	O	シクロプロピル	Me	H	5,6-ジクロピリジン-3-イル	3.27	423
121	F	F	O	シクロプロピル	Me	H	5,6-ジクロピリジン-3-イル	3.11	407
122	F	F	O	シクロプロピル	H	H	3-メチル-1-ベンゾチオフェン-2-イル	3.64	394
123	Cl	F	O	シクロプロピル	H	H	3-メチル-1-ベンゾチオフェン-2-イル	3.74	410
124	F	F	S	シクロプロピル	H	H	3-メチル-1-ベンゾチオフェン-2-イル	4.31	410

10

20

30

40

実施例	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	質量 (M+H)
125	F	F	O	H				3.39	358
126	Cl	F	O	H				3.57	374
127	Cl	F	O	シクロプロピル	Me	H	2,5-シクロプロ-3-チエニル	4.24	428
128	F	F	O	シクロプロピル	Me	H	2,5-シクロプロ-3-チエニル	4.03	412
129	Cl	F	O	メチル	H	H	5-メチル-3-フェニル-1,2-オキサゾール-4-イル	2.59	395
130	F	F	O	メチル	H	H	5-メチル-3-フェニル-1,2-オキサゾール-4-イル	2.44	379
131	F	F	O	シクロプロピル	H	H	5-メチル-2-フェニル-2H-1,2,3-トリアゾール-4-イル	3.29	405
132	F	F	S	シクロプロピル	H	H	5-メチル-2-フェニル-2H-1,2,3-トリアゾール-4-イル	4.04	421
133	F	F	O	メチル	H	H	4-ブロモ-3-チエニル	2.52	382
134	Cl	F	O	メチル	H	H	4-ブロモ-3-チエニル	2.70	398
135	F	F	O	シクロプロピル	H	H	3-ブロモ-2-チエニル	3.11	408
136	Cl	F	O	シクロプロピル	H	H	3-ブロモ-2-チエニル	3.29	424
137	F	F	O	シクロプロピル	H	H	6-クロロキノリン-4-イル	2.44	409
138	F	F	O	シクロプロピル	H	H	2-クロロキノリン-4-イル	2.92	409
139	Cl	F	O	シクロプロピル	H	H	2-クロロキノリン-4-イル	3.09	425

10

20

30

40

実施例	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	質量 (M+H)
140	F	F	O	シクロプロピル	H	H	2-メチル-4-(トリフルオロメチル)- 1,3-チアゾール-5-イル	2.75	413
141	Cl	F	O	メチル	H	H	3-クロロ-1-ベンゾチオフェン-2-イル	3.63	404
142	F	F	O	メチル	H	H	3-クロロ-1-ベンゾチオフェン-2-イル	3.48	388
143	F	F	O	シクロプロピル	H	H	5-クロロ-1-ベンゾチオフェン-3-イル	3.73	414
144	Cl	F	O	シクロプロピル	H	H	5-クロロ-1-ベンゾチオフェン-3-イル	3.83	430
145	F	F	S	シクロプロピル	H	H	5-クロロ-1-ベンゾチオフェン-3-イル	4.36	430
146	Cl	F	O	シクロプロピル	H	H	2,5-ジメチル-1-フェニル- 1H-ピロール-3-イル	3.94	433
147	F	F	O	シクロプロピル	Me	H	2-メチル-5-フェニル- 3-チエンル	4.41	434
148	Cl	F	O	メチル	H	H	4-メチル-2-フェニル- 1,3-チアゾール-5-イル	2.90	411
149	F	F	O	メチル	H	H	4-メチル-2-フェニル- 1,3-チアゾール-5-イル	2.77	395
150	F	F	O	イソプロピル	H	H	1-(4-クロロフェニル)- 1H-ピラゾール-4-イル	3.25	426
151	Cl	F	O	イソプロピル	H	H	1-(4-クロロフェニル)- 1H-ピラゾール-4-イル	3.39	442
152	F	F	O	メチル	H	H	3-(4-クロロフェニル)- 1,2-オキサゾール-5-イル	3.04	399
153	F	F	O	シクロプロピル	H	H	3-(4-クロロフェニル)- 1,2-オキサゾール-5-イル	3.46	425
154	Cl	F	O	シクロプロピル	H	H	3-(4-クロロフェニル)- 1,2-オキサゾール-5-イル	3.59	441
155	F	F	O	シクロプロピル	H	H	1-フェニル-1H-インドール-2-イル	3.96	439
156	Cl	F	O	シクロプロピル	H	H	1-フェニル-1H-インドール-2-イル	4.13	455
157	F	F	O	メチル	i-Pr	H	2-(メチルスルファニル)- 4-(トリフルオロメチル) ピリミジン-5-イル	3.46	456

10

20

30

40

実施例	X ¹	X ²	T	Z ¹	Z ²	Z ³	B	logP	質量 (M+H)
158	Cl	F	O	メチル	i-Pr	H	2-(メチルスルファニル)- 4-(トリフルオロメチル) ピリミジン-5-イル	3.59	472
159	F	F	O	シクロプロピル	H	H	2-(トリフルオロメチル) キノリン-4-イル	3.58	443
160	Cl	F	O	シクロプロピル	H	H	2-(トリフルオロメチル) キノリン-4-イル	3.72	459
161	F	F	S	シクロプロピル	H	H	2-(トリフルオロメチル) キノリン-4-イル	4.26	459
162	Cl	F	O	シクロプロピル	H	H	5,7-ジクロロ キノリン-4-イル	3.57	459
163	F	F	O	シクロプロピル	H	H	5,7-ジクロロ キノリン-4-イル	3.39	443
164	F	F	O	メチル	H	H	3-(3,4,5-トリフルオロフェニル)- 1,2-オキサゾール-5-イル	3.11	419
165	F	F	O	シクロプロピル	H	H	3-(3,4,5-トリフルオロフェニル)- 1,2-オキサゾール-5-イル	3.53	445
166	Cl	F	O	シクロプロピル	H	H	3-(3,4,5-トリフルオロフェニル)- 1,2-オキサゾール-5-イル	3.64	461
167	F	F	O	シクロプロピル	H	H	2-(4-クロロフェニル)-4-メチル- 1,3-チアゾール-5-イル	3.85	455
168	Cl	F	O	シクロプロピル	H	H	2-(4-クロロフェニル)-4-メチル- 1,3-チアゾール-5-イル	4.01	471
169	F	F	O	シクロプロピル	H	H	5-クロロ-3-イソプロピル-1- フェニル-1H-ピラゾール-4-イル	3.94	466
170	F	F	O	シクロプロピル	H	H	5-(シフルオロメチル)- 1-メチル-3-(トリフルオロメチル)- 1H-ピラゾール-4-イル	2.76	

10

20

30

注記⁽¹⁾: Me:メチル; i-Pr:イソプロピル

下記実施例により、本発明の式(I)で表される化合物の調製及び効力について非限定的に例証する。

40

【実施例】

【0131】

5-クロロ-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸(実施例IIIIa-1)の合成

500 mL容フラスコの中で、30 mLのトルエンに、6.0 g(31 mmol)の5-クロロ-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルバルデヒドを添加する。その反応混合物に、その温度を37℃未満に維持しながら、2.4 g(62 mmol)の水酸化ナトリウムを6 mLの水に溶解させた溶液を添加した後、過酸化水素の30%水溶液103 mLを添加する。その添加が完了した後、その反応混合物を50℃で7時間攪拌する。その反応混合物を室温まで戻したら、2相を分離させ、その有機

50

相を100 mLの水で抽出する。その水相を合して水性塩酸で酸性化してpH 2とする。生じた白色の沈澱物を濾過し、20 mLの水で2回洗浄し、乾燥させて、3.2 gの5-クロロ-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸を白色の固体として得る。

$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) ppm: 3.78 (s, 3H); 7.12 (t, 1H, $J_{\text{HF}} = 53.60$ Hz); 13.19 (s, 1H); IR (KBr): 1688 cm^{-1} (C=O); 2200-3200 cm^{-1} 広幅(水素結合)。

【0132】

5-クロロ-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボニルクロリド(実施例 I I I b - 1)の合成

3.2 gの5-クロロ-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸及び44.3 mLの塩化チオニルを5時間還流する。冷却後、その反応混合物を減圧下に蒸発させて、3.5 gの5-クロロ-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボニルクロリドを黄色の油状物として得る。

$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, CHCl_3-d_6) ppm: 3.97 (s, 3H); 7.00 (t, $J = 52.01$ Hz, 1H); IR (TQ): 1759 cm^{-1} 及び 1725 cm^{-1} (C=O)。

【0133】

3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボニルフルオリド(実施例 I I I c - 1)の合成

4.0 g (70 mmol)のフッ化カリウムを21 mLのテトラヒドロチオフェン-1,1-ジオキシドに溶解させて脱水した溶液に、100 で、5.0 g (22 mmol)の5-クロロ-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボニルクロリドを15 mLのトルエンに溶解させた溶液を添加する。得られた反応混合物を190~200 で22時間攪拌する。減圧下で蒸留して、テトラヒドロチオフェン-1,1-ジオキシド中の3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボニルフルオリドの8 gの溶液(25モル%)を得る。

$^1\text{H NMR}$ (250 MHz, CHCl_3-d_6) ppm: 3.87 (s, 3H); 6.79 (t, $J = 53.75$ Hz, 1H); $^{19}\text{F NMR}$ (250 MHz, CHCl_3-d_6) ppm: 45.37 (s, COF); -117.5 (d, $J = 28.2$ Hz); -131.6 (m)。

【0134】

3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸(実施例 I I I d - 1)の合成

400 mLの1N水酸化ナトリウム水溶液に、テトラヒドロチオフェン-1,1-ジオキシド中の3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボニルフルオリドの67.5 gの溶液(10モル%)を滴下して加える。その添加中は、温度を20 未満に維持する。室温で2時間攪拌した後、その反応混合物を、水性濃塩酸を用いて、注意深く酸性化して、pH 2とする。生じた白色の沈澱物を濾過し、水で洗浄し、乾燥させて、6 gの3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸を白色の固体として得る。

$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) ppm: 3.90 (s, 3H); 7.22 (t, 1H, $J_{\text{HF}} = 53.55$ Hz); 13.33 (s, 1H)。

【0135】

3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボニルクロリド(実施例 I I I e - 1)の合成

9.1 gの3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸及び75.5 mLの塩化チオニルを1.5時間還流する。冷却後、その反応混合物を減圧下で蒸発させて、10 gの3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-

10

20

30

40

50

1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボニルクロリドを黄色の油状物として得る。
GC - MS ; 観測された M / z : 分子イオン : (M ⁺) = 212 ; フラグメント :
(M ⁺ - Cl) = 177、及び、(M ⁺ - F) = 193。

【0136】

一般的な調製実施例 2 : ChemspeedTM 装置上での式 (I) で表されるアミドの調製

13 mL 容 ChemspeedTM バイアルの中に、ジクロロメタン中のアミン (I I) の 0.15 モル溶液 4 mL (0.60 mmole) を入れた後、0.72 mmole のトリエチルアミンを入れる。1 分間あたり 1 mL の速度で、塩化アシル (I I I b) 又は (I I I e) の 0.30 モル溶液 2 mL (0.60 mmole) を添加し、得られた混合物を、次いで、室温で一晩攪拌する。次いで、1 mL の水を添加し、その混合物を塩基性アルミナカートリッジ (2 g) の上に注ぎ、ジクロロメタンで溶離させる。溶媒を除去し、得られた粗製アミド誘導体を LCMS と NMR で分析する。充分には純粋でない化合物は、分取 LCMS でさらに精製する。

10

【0137】

一般的な調製実施例 3 : ChemspeedTM 装置上での式 (I) で表されるアミドのチオン化 (thionation)

13 mL 容 ChemspeedTM バイアルの中に、0.27 mmole の五硫化リン (P₂S₅) を量って入れる。ジオキサン中のアミド (I) の 0.18 モル溶液 3 mL (0.54 mmole) を添加し、得られた混合物を還流温度で 2 時間加熱する。次いで、その温度を 80 °C まで下げ、2.5 mL の水を添加する。その混合物を 80 °C でさらに 1 時間加熱する。次いで、2 mL の水を添加し、その反応混合物を 4 mL のジクロロメタンで 2 回抽出する。その有機相を塩基性アルミナカートリッジ (2 g) の上にデポジットさせ、8 mL のジクロロメタンで 2 回溶離させる。溶媒を除去し、得られた粗製チオアミド誘導体を LCMS と NMR で分析する。充分には純粋でない化合物は、分取 LCMS でさらに精製する。

20

【0138】

実施例 A : スファエロテカ・フリギネア (Sphaerotheca fuliginea) (キュウリ) に対するインビボ予防試験

溶媒 : 49 重量部の N , N - ジメチルホルムアミド

乳化剤 : 1 重量部のアルキルアールポリグリコールエーテル

30

活性化化合物の適切な調製物を調製するために、1 重量部の活性化化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を水で希釈して、所望の濃度とする。

【0139】

予防活性について試験するために、幼植物に、活性化化合物の該調製物を記載されている施用量で噴霧する。この処理の 1 日後、該植物に、スファエロテカ・フリギネア (Sphaerotheca fuliginea) の孢子の水性懸濁液を用いて接種する。次いで、その植物を、約 23 °C で相対大気湿度約 70 % の温室の中に置く。

【0140】

当該試験について、上記接種の 7 日後に評価する。0 % は、処理されていない対照の効力に相当する効力を意味し、100 % の効力は、病害が観察されないことを意味する。

40

【0141】

これらの条件下、表 A の下記化合物を活性成分の薬量 500 ppm で用いて、良好な保護 (少なくとも 70 %) から完全な保護までが観察される :

表 A :

【0142】

【表 5】

実施例	効力	実施例	効力	実施例	効力
32	95	91	88	137	90
34	70	95	88	140	100
40	90	96	100	143	95
50	100	115	83	145	93
69	70	117	95	147	88
70	98	124	98	161	100
73	85	128	98	163	100
80	99	131	97	169	100
85	94	132	100	170	88

10

同じ条件下、表 A 2 に示されているように、化合物 69 を活性成分の薬量 500 ppm で用いて良好な保護（少なくとも 70%）が観察されるが、特許出願 CN-1188764 に開示されている実施例 186 の化合物では全く保護されないのが観察される。

【0143】

表 A 2 :

【0144】

【表 6】

実施例	薬量 (ppm)	効力
本特許の69	500	70
CN-1188764の186	500	0

20

国際特許 CN-1188764 に開示されている実施例 186 は、「5-クロロ-N-[(6-クロロピリジン-3-イル)メチル]-1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド」に対応する。

【0145】

これらの結果は、本発明による化合物が CN-1188764 に開示されている構造的に最も近い化合物よりも極めて優れた生物学的活性を有していることを示している。

30

【0146】

実施例 B : アルテルナリア・ソラニ (*Alternaria solani*) (トマト) に対するインビボ予防試験

溶媒 : 49 重量部の N, N - ジメチルホルムアミド

乳化剤 : 1 重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

活性化化合物の適切な調製物を調製するために、1 重量部の活性化化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を水で希釈して、所望の濃度とする。

【0147】

予防活性について試験するために、幼植物に、活性化化合物の該調製物を記載されている施用量で噴霧する。この処理の 1 日後、該植物に、アルテルナリア・ソラニ (*Alternaria solani*) の胞子の水性懸濁液を用いて接種する。その植物を、約 22 で相対大気湿度 100% のインキュベーション室の中に 1 日間置く。次いで、その植物を、約 20 で相対大気湿度 96% のインキュベーション室の中に置く。

40

【0148】

当該試験について、上記接種の 7 日後に評価する。0% は、処理されていない対照の効力に相当する効力を意味し、100% の効力は、病害が観察されないことを意味する。

【0149】

これらの条件下、表 B の下記化合物を活性成分の薬量 500 ppm で用いて、良好な保護（少なくとも 70%）から完全な保護までが観察される：

表 B :

50

【 0 1 5 0 】

【 表 7 】

実施例	効 力	実施例	効 力	実施例	効 力
5	80	90	95	124	100
10	100	91	95	125	94
28	90	93	100	127	95
32	70	94	95	128	100
37	80	95	95	131	90
39	95	96	95	132	90
40	95	98	80	133	70
42	70	100	95	137	80
48	95	103	94	138	95
49	80	104	94	140	80
50	95	105	95	142	80
67	95	106	95	143	95
70	100	108	90	145	90
71	95	109	95	147	95
73	90	111	95	149	80
75	70	114	95	153	90
81	100	115	100	155	95
82	100	116	90	157	70
83	94	117	100	165	100
85	80	118	95	167	90
86	70	120	90	169	100
88	78	121	95	170	95
89	80	122	95		

10

20

同じ条件下、表 B 2 に示されているように、化合物 1 3 8 を活性成分の薬量 5 0 0 p p m で用いて優れた保護（95%を超える）が観察されるが、WO - 2 0 0 9 / 0 1 6 2 2 1 において特許請求されているデス - フルオロ類似体化合物 C M P 1 では全く保護されないのが観察される。

30

【 0 1 5 1 】

表 B 2 :

【 0 1 5 2 】

【 表 8 】

実施例	薬量 (ppm)	効 力
本特許の138	500	95
WO-2009/016221のCMP1	500	0

WO - 2 0 0 8 / 0 1 6 2 2 1 において特許請求されているデス - フルオロ類似体化合物 C M P 1 は、「N - [(2 - クロロキノリン - 4 - イル) メチル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド」に対応する。

40

【 0 1 5 3 】

これらの結果は、本発明による化合物が WO - 2 0 0 8 / 0 1 6 2 2 1 に開示されている構造的に最も近い化合物よりも極めて優れた生物学的活性を有していることを示している。

【 0 1 5 4 】

同じ条件下、表 B 3 に示されているように、化合物 7 1 を活性成分の薬量 5 0 0 p p m で用いて優れた保護（少なくとも95%）が観察されるが、特許出願 WO - 2 0 0 9 / 0 1 6 2 2 2 に開示されている実施例 2 8 の化合物では全く保護されないのが観察される。

50

【 0 1 5 5 】

表 B 3 :

【 0 1 5 6 】

【 表 9 】

実施例	薬量 (ppm)	効力
本特許の71	500	95
WO-2009/016222の28	500	0

国際特許 WO - 2 0 0 9 / 0 1 6 2 2 2 に開示されている実施例 2 8 は、「N - (1 - ベンゾフラン - 2 - イルメチル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド」に対応する。

10

【 0 1 5 7 】

これらの結果は、本発明による化合物が WO - 2 0 0 9 / 0 1 6 2 2 2 に開示されている構造的に最も近い化合物よりも優れた生物学的活性を有していることを示している。

【 0 1 5 8 】

同じ条件下、表 B 4 に示されているように、化合物 1 0 を活性成分の薬量 5 0 0 p p m で用いて完全な保護が観察されるが、特許出願 CN - 1 1 8 8 7 6 4 に開示されている実施例 1 6 8 の化合物では全く保護されないのが観察される。

【 0 1 5 9 】

20

表 B 4 :

【 0 1 6 0 】

【 表 1 0 】

実施例	薬量 (ppm)	効力
本特許の10	500	100
CN-1188764の168	500	0

国際特許 CN - 1 1 8 8 7 6 4 に開示されている実施例 1 6 8 は、「5 - クロロ - N - (2 - フリルメチル) - 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド」に対応する。

30

【 0 1 6 1 】

これらの結果は、本発明による化合物が CN - 1 1 8 8 7 6 4 に開示されている構造的に最も近い化合物よりも極めて優れた生物学的活性を有していることを示している。

【 0 1 6 2 】

実施例 C : ピレノホラ・テレス (Pyrenophora teres) (オオムギ) に対するインビボ予防試験

溶媒 : 4 9 重量部の N , N - ジメチルホルムアミド

乳化剤 : 1 重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を調製するために、1 重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を水で希釈して、所望の濃度とする。

40

【 0 1 6 3 】

予防活性について試験するために、幼植物に、活性化合物の該調製物を記載されている施用量で噴霧する。この処理の 1 日後、該植物に、ピレノホラ・テレス (Pyrenophora teres) の孢子の水性懸濁液を用いて接種する。その植物を、2 2 で相対大気湿度 1 0 0 % のインキュベーション室の中に 4 8 時間置く。次いで、その植物を、温度約 2 0 で相対大気湿度約 8 0 % の温室の中に置く。

【 0 1 6 4 】

当該試験について、上記接種の 7 ~ 9 日後に評価する。0 % は、処理されていない対照の効力に相当する効力を意味し、1 0 0 % の効力は、病害が観察されないことを意味する

50

。

【 0 1 6 5 】

これらの条件下、表 C の下記化合物を活性成分の薬量 5 0 0 p p m で用いて、良好な保護（少なくとも 7 0 % ）から完全な保護までが観察される：

表 C :

【 0 1 6 6 】

【 表 1 1 】

実施例	効力	実施例	効力	実施例	効力
5	95	94	95	138	100
15	75	95	100	139	90
21	80	96	100	140	100
23	100	98	100	142	100
31	100	102	70	143	100
32	100	105	100	144	100
35	100	106	100	145	100
39	100	107	80	147	100
40	100	109	100	149	80
48	100	110	100	151	75
49	95	111	100	153	100
50	100	112	95	154	100
67	90	114	95	155	100
70	100	115	100	156	90
71	100	116	95	157	90
72	90	117	100	159	100
73	100	118	100	160	90
75	89	120	100	161	100
80	100	121	100	162	94
81	90	122	100	163	94
82	90	123	90	164	100
85	100	124	100	165	100
86	100	127	95	166	90
89	95	128	100	167	100
90	100	131	95	168	70
91	100	132	100	169	100
92	100	133	90	170	100
93	100	137	100		

10

20

30

実施例 D : ベンツリア・イナエクアリス (*Venturia inaequalis*) (リンゴ黒星病) に対するインピボ予防試験

溶媒 : 2 4 . 5 重量部のアセトン

2 4 . 5 重量部の N , N - ジメチルアセトアミド

乳化剤 : 1 重量部のアルキルアールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を調製するために、1 重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を水で希釈して、所望の濃度とする。

【 0 1 6 7 】

予防活性について試験するために、幼植物に、活性化合物の該調製物を記載されている施用量で噴霧する。噴霧による被膜が乾燥した後、該植物に、リンゴ黒星病の病原であるベンツリア・イナエクアリス (*Venturia inaequalis*) の分生子の水懸濁液を用いて接種し、次いで、その植物を、約 2 0 で相対大気湿度 1 0 0 % のインキュベーション室の中に 1 日間置く。

【 0 1 6 8 】

40

50

次いで、その植物を、約 2 1 で相対大気湿度約 9 0 % の温室の中に置く。

【 0 1 6 9 】

当該試験について、上記接種の 1 0 日後に評価する。0 % は、処理されていない対照の効力に相当する効力を意味し、1 0 0 % の効力は、病害が観察されないことを意味する。

【 0 1 7 0 】

これらの条件下、表 D の下記化合物を活性成分の薬量 1 0 0 p p m で用いて、優れた保護（少なくとも 9 8 % ）から完全な保護までが観察される：

表 D :

【 0 1 7 1 】

【 表 1 2 】

実施例	効力	実施例	効力	実施例	効力
70	100	91	100	132	98
80	100	95	99	147	100
85	100	128	100	169	99

同じ条件下、表 D 2 に示されているように、化合物 8 5 を活性成分の薬量 1 0 p p m で用いて優れた保護（少なくとも 9 9 % ）が観察されるが、特許出願 WO - 2 0 0 9 / 0 1 6 2 2 2 に開示されている実施例 1 7 の化合物では弱い保護（2 5 % 未満）が観察される。

【 0 1 7 2 】

表 D 2 :

【 0 1 7 3 】

【 表 1 3 】

実施例	薬量 (ppm)	効力
本特許の85	10	99
WO-2009/016222の17	10	21

国際特許 WO - 2 0 0 9 / 0 1 6 2 2 2 に開示されている実施例 1 7 は、「N - [1 - (1 - ベンゾチオフェン - 3 - イル) エチル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド」に対応する。

【 0 1 7 4 】

これらの結果は、本発明による化合物が WO - 2 0 0 9 / 0 1 6 2 2 2 に開示されている構造的に最も近い化合物よりも優れた生物学的活性を有していることを示している。

【 0 1 7 5 】

同じ条件下、表 D 3 に示されているように、化合物 1 6 9 を活性成分の薬量 1 0 0 p p m 及び 1 0 p p m で用いて優れた保護（9 5 % を超える）から平均的な保護（5 0 % を超える）までが観察されるが、WO - 2 0 0 8 / 0 1 5 1 8 9 において特許請求されているデス - フルオロ類似体化合物 CMP 2 では平均的な保護（6 0 % 未満）から極めて劣った保護（5 % 未満）までが観察される。

【 0 1 7 6 】

表 D 3 :

【 0 1 7 7 】

【 表 1 4 】

実施例	薬量 (ppm)	効力
本特許の169	100	99
	10	56
WO-2008/015189のCMP2	100	53
	10	4

10

20

30

40

50

WO - 2008 / 015189 において特許請求されているデス - フルオロ類似体化合物 CMP 2 は、「N - [(5 - クロロ - 3 - イソプロピル - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) メチル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド」に対応する。

【0178】

これらの結果は、本発明による化合物が WO - 2008 / 015189 に開示されている構造的に最も近い化合物よりも優れた生物学的活性を有していることを示している。

【0179】

実施例 E : セプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) (コムギ) に対するインビボ予防試験

溶媒 : 49 重量部の N , N - ジメチルアセトアミド

乳化剤 : 1 重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を調製するために、1 重量部の活性化合物又は活性化合物組合せを上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を水で希釈して、所望の濃度とする。

【0180】

予防活性について試験するために、幼植物に、活性化合物又は活性化合物組合せの該調製物を記載されている施用量で噴霧する。

【0181】

噴霧による被膜が乾燥した後、該植物に、セプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) の胞子の懸濁液を噴霧する。その植物を、約 20 で相対大気湿度約 100 % のインキュベーション室の中に 48 時間置き、その後、相対大気湿度約 100 % の半透明のインキュベーション室の中に約 15 で 60 時間置く。

【0182】

その植物を、温度約 15 で相対大気湿度約 80 % の温室の中に置く。

【0183】

当該試験について、上記接種の 21 日後に評価する。0 % は、処理されていない対照の効力に相当する効力を意味し、100 % の効力は、病害が観察されないことを意味する。

【0184】

これらの条件下、表 E の下記化合物を活性成分の薬量 500 ppm で用いて、良好な保護 (少なくとも 70 %) から完全な保護までが観察される :

表 E :

【0185】

【表 15】

実施例	効力	実施例	効力	実施例	効力
40	100	85	90	122	100
48	100	90	100	128	90
50	71	91	100	143	100
70	100	93	100	147	80
71	100	95	80	155	100
80	100	115	86	169	100

実施例 F : ブルメリア・グラミニス (*Blumeria graminis*) (オオムギ) に対するインビボ予防試験

溶媒 : 49 重量部の N , N - ジメチルアセトアミド

乳化剤 : 1 重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を調製するために、1 重量部の活性化合物又は活性化合物組合せを上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を水で希釈して、所望の濃度とする。

10

20

30

40

50

【0186】

予防活性について試験するために、幼植物に、活性化合物又は活性化合物組合せの該調製物を記載されている施用量で噴霧する。

【0187】

噴霧による被膜が乾燥した後、該植物に、ブルメリア・グラミニス f. sp. ホルデイ (*Blumeria graminis* f. sp. *hordei*) の胞子を振りかける。

【0188】

その植物を、温度約 18 で相対大気湿度約 80% の温室の中に置いて、うどんこ病によるいぼ状隆起 (*mildew pustule*) の発生を促進する。

10

【0189】

当該試験について、上記接種の 7 日後に評価する。0% は、処理されていない対照の効力に相当する効力を意味し、100% の効力は、病害が観察されないことを意味する。

【0190】

これらの条件下、表 F の下記化合物を活性成分の薬量 500 ppm で用いて、良好な保護 (少なくとも 70%) から完全な保護までが観察される：

表 F：

【0191】

【表 16】

実施例	効力	実施例	効力	実施例	効力
40	100	85	100	143	94
48	100	90	100	147	70
50	89	91	94	155	70
70	80	93	94	169	100
71	89	95	100		
80	86	128	100		

20

実施例 G：フサリウム・ニバレ (*Fusarium nivale*) (コムギ) に対するインビボ治療試験

溶媒： 49 重量部の N, N - ジメチルアセトアミド

乳化剤： 1 重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を調製するために、1 重量部の活性化合物又は活性化合物組合せを上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を水で希釈して、所望の濃度とする。

30

【0192】

治療活性について試験するために、幼植物に、サンドブラストを用いて僅かに傷を付け、その後、フサリウム・ニバレ (var. マジユス) (*Fusarium nivale* (var. *majus*)) の分生子の懸濁液を噴霧し、その植物を、温室内の温度約 10 で相対大気湿度約 100% の半透明のインキュベーション室の中に 24 時間置き、その後、活性化合物の該調製物を記載されている施用量で噴霧する。

40

【0193】

噴霧による被膜が乾燥した後、該植物を、温室内の温度約 10 で相対大気湿度約 100% の半透明のインキュベーションクロージュの中に置く。

【0194】

当該試験について、上記接種の 5 日後に評価する。0% は、処理されていない対照の効力に相当する効力を意味し、100% の効力は、病害が観察されないことを意味する。これらの条件下、表 G の下記化合物を活性成分の薬量 500 ppm で用いて、良好な保護 (少なくとも 70%) から完全な保護までが観察される：

表 G：

【0195】

50

【表 17】

実施例	効力	実施例	効力	実施例	効力
40	92	90	100	128	100
48	86	91	71	147	92
70	100	93	71	155	100
71	100	95	86	169	83
80	93	115	71		
85	100	122	93		

実施例 H : レプトスファエリア・ノドルム (Leptosphaeria nodorum) (コムギ) に対するインビボ予防試験

10

溶媒 : 49 重量部の N, N - ジメチルアセトアミド

乳化剤 : 1 重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

活性化化合物の適切な調製物を調製するために、1 重量部の活性化化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を水で希釈して、所望の濃度とする。

【0196】

予防活性について試験するために、幼植物に、活性化化合物の調製物を記載されている施用量で噴霧する。この処理の1日後、該植物に、レプトスファエリア・ノドルム (Leptosphaeria nodorum) の胞子の水性懸濁液を用いて接種する。その植物を、22 で相対大気湿度 100% のインキュベーション室の中に 48 時間置く。次いで、その植物を、温度約 22 で相対大気湿度約 90% の温室の中に置く。

20

【0197】

当該試験について、上記接種の 7 ~ 9 日後に評価する。0% は、処理されていない対照の効力に相当する効力を意味し、100% の効力は、病害が観察されないことを意味する。

【0198】

これらの条件下、表 H の下記化合物を活性成分の薬量 500 ppm で用いて、良好な保護 (少なくとも 70%) から完全な保護までが観察される :

表 H :

【0199】

30

【表 18】

実施例	効力	実施例	効力	実施例	効力
48	100	85	100	128	100
50	71	90	100	147	93
70	83	91	100	155	80
71	80	115	80	169	100
80	100	122	100		

実施例 I : ウロミセス・アペンジクラツス (Uromyces appendiculatus) (インゲンマメ) に対するインビボ予防試験

40

溶媒 : 24.5 重量部のアセトン

24.5 重量部の N, N - ジメチルアセトアミド

乳化剤 : 1 重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

活性化化合物の適切な調製物を調製するために、1 重量部の活性化化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を水で希釈して、所望の濃度とする。

【0200】

予防活性について試験するために、幼植物に、活性化化合物の該調製物を記載されている施用量で噴霧する。噴霧による被膜が乾燥した後、該植物に、インゲンマメさび病の病原であるウロミセス・アペンジクラツス (Uromyces appendiculatus) の胞子の水性懸濁液を用いて接種し、次いで、その植物を、約 20 で相対大気湿度

50

100%のインキュベーション室の中に1日間置く。

【0201】

次いで、その植物を、約21で相対大気湿度約90%の温室の中に置く。

【0202】

当該試験について、上記接種の10日後に評価する。0%は、処理されていない対照の効力に相当する効力を意味し、100%の効力は、病害が観察されないことを意味する。

【0203】

これらの条件下、表Iの下記化合物を活性成分の薬量100ppmで用いて、高い保護(少なくとも80%)から完全な保護までが観察される：

表I：

【0204】

【表19】

実施例	効力
70	100
95	90
128	100
147	83
169	100

10

実施例J：プッシニア・トリチシナ (Puccinia triticina) (コムギ) に対するインピボ保護試験

20

溶媒： 49重量部のN,N-ジメチルアセトアミド

乳化剤： 1重量部のアルキルアールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を調製するために、1重量部の活性化合物又は活性化合物組合せを上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を水で希釈して、所望の濃度とする。

【0205】

予防活性について試験するために、幼植物に、活性化合物又は活性化合物組合せの該調製物を記載されている施用量で噴霧する。

【0206】

噴霧による被膜が乾燥した後、該植物に、プッシニア・トリチシナ (Puccinia triticina) の胞子の懸濁液を噴霧する。その植物を、約20で相対大気湿度約100%のインキュベーション室の中に48時間置く。

【0207】

その植物を、温度約20で相対大気湿度約80%の温室の中に置く。

【0208】

当該試験について、上記接種の8日後に評価する。0%は、処理されていない対照の効力に相当する効力を意味し、100%の効力は、病害が観察されないことを意味する。

【0209】

これらの条件下、表Jの下記化合物を活性成分の薬量500ppmで用いて、良好な保護(少なくとも70%)から完全な保護までが観察される：

40

表J：

【0210】

【表20】

実施例	効力	実施例	効力	実施例	効力
40	71	91	100	128	100
80	100	93	100	155	75
85	100	95	83	169	100
90	88	122	100		

50

同じ条件下、表 J 2 に示されているように、化合物 85 を活性成分の薬量 500 ppm で用いて完全な保護が観察されるが、特許出願 WO - 2009 / 016222 に開示されている実施例 17 の化合物では弱い保護 (25%未満) が観察される。

【0211】

表 J 2 :

【0212】

【表 2 1】

実施例	薬量 (ppm)	効力
本特許の85	500	100
WO-2009/016222の17	500	20

10

国際特許 WO - 2009 / 016222 に開示されている実施例 17 は、「N - [1 - (1 - ベンゾチオフェン - 3 - イル) エチル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド」に対応する。

【0213】

これらの結果は、本発明による化合物が WO - 2009 / 016222 に開示されている構造的に最も近い化合物よりも極めて優れた生物学的活性を有しているということを示している。

【0214】

20

実施例 K : ボトリチス・シネレア (Botrytis cinerea) (インゲンマメ) に対するインピボ保護試験

溶媒 : 24.5 重量部のアセトン

24.5 重量部の N, N - ジメチルアセトアミド

乳化剤 : 1 重量部のアルキルアールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を調製するために、1 重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を水で希釈して、所望の濃度とする。

【0215】

予防活性について試験するために、幼植物に、活性化合物の該調製物を噴霧する。噴霧による被膜が乾燥した後、増殖したボトリチス・シネレア (Botrytis cinerea) で覆われている寒天の小片 2 個を各葉の上に置く。その接種された植物を、20 で相対大気湿度 100% の暗室の中に置く。

30

【0216】

上記接種の 2 日後に、当該葉の表面上の病斑の寸法について評価する。0% は、処理されていない対照の効力に相当する効力を意味し、100% の効力は、病害が観察されないことを意味する。

【0217】

これらの条件下、表 J の下記化合物を活性成分の薬量 100 ppm で用いて、優れた保護 (少なくとも 95%) から完全な保護までが観察される :

表 K :

40

【0218】

【表 2 2】

実施例	効力
70	95
80	100
128	100
147	100
169	100

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No PCT/EP2011/069206

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER		
INV. C07D401/12	C07D403/12	C07D405/12
C07D417/12	A01N43/56	A01N43/647
A01N43/828	A01N43/832	A01N43/836
C07D409/12		
C07D413/12		
A01N43/74		
A01N43/78		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D A01N		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used) EPO-Internal, WPI Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X, P	WO 2010/130767 A2 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; BARTELS GUENTER [DE]; BECKER ANGELA [DE]; B) 18 November 2010 (2010-11-18) cited in the application claims 1,3-12,19,21,22; examples 7,57,58,62,72,87,90 -----	1-7, 11-13
A	WO 2009/016222 A1 (BAYER CROPSCIENCE SA [FR]; DESBORDES PHILIPPE [FR]; GARY STEPHANIE [FR]) 5 February 2009 (2009-02-05) cited in the application in particular the claims and examples 13-18 ----- -/--	1-13
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.		
* Special categories of cited documents :		
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier document but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed		"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art. "&" document member of the same patent family
Date of the actual completion of the international search 24 January 2012		Date of mailing of the international search report 01/02/2012
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Hanisch, Inken

1

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No PCT/EP2011/069206

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	<p>WO 2009/016221 A1 (BAYER CROPSCIENCE SA [FR]; DESBORDES PHILIPPE [FR]; GARY STEPHANIE [FR]) 5 February 2009 (2009-02-05) cited in the application in particular the claims and, e.g., examples 50, 52 and 89 -----</p>	1-13

1

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2011/069206

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2010130767 A2	18-11-2010	AR 076839 A1	13-07-2011
		AU 2010247385 A1	22-12-2011
		CA 2761269 A1	18-11-2010
		TW 201043138 A	16-12-2010
		WO 2010130767 A2	18-11-2010

WO 2009016222 A1	05-02-2009	CN 101765598 A	30-06-2010
		EP 2185545 A1	19-05-2010
		JP 2010534717 A	11-11-2010
		US 2010130570 A1	27-05-2010
		WO 2009016222 A1	05-02-2009

WO 2009016221 A1	05-02-2009	AR 067744 A1	21-10-2009
		AU 2008281773 A1	05-02-2009
		CN 101772486 A	07-07-2010
		EP 2185507 A1	19-05-2010
		JP 2010534716 A	11-11-2010
		RU 2010107281 A	20-09-2011
		US 2010144785 A1	10-06-2010
		WO 2009016221 A1	05-02-2009

フロントページの続き

(51)Int.Cl.	F I	テーマコード(参考)
C 0 7 D 413/12 (2006.01)	C 0 7 D 413/12	
C 0 7 D 409/12 (2006.01)	C 0 7 D 409/12	
C 0 7 D 417/12 (2006.01)	C 0 7 D 417/12	
A 6 1 K 31/4155 (2006.01)	A 6 1 K 31/4155	
A 6 1 K 31/4439 (2006.01)	A 6 1 K 31/4439	
A 6 1 K 31/506 (2006.01)	A 6 1 K 31/506	
A 6 1 K 31/4245 (2006.01)	A 6 1 K 31/4245	
A 6 1 K 31/427 (2006.01)	A 6 1 K 31/427	
A 6 1 K 31/4178 (2006.01)	A 6 1 K 31/4178	
A 6 1 K 31/428 (2006.01)	A 6 1 K 31/428	
A 6 1 K 31/433 (2006.01)	A 6 1 K 31/433	
A 6 1 K 31/422 (2006.01)	A 6 1 K 31/422	
A 6 1 K 31/4192 (2006.01)	A 6 1 K 31/4192	
A 6 1 K 31/4709 (2006.01)	A 6 1 K 31/4709	
A 0 1 N 43/56 (2006.01)	A 0 1 N 43/56	C
A 0 1 N 43/832 (2006.01)	A 0 1 N 43/82	1 0 3
A 0 1 N 43/78 (2006.01)	A 0 1 N 43/78	B
A 0 1 N 43/80 (2006.01)	A 0 1 N 43/78	A
A 0 1 N 43/836 (2006.01)	A 0 1 N 43/78	1 0 1
A 0 1 N 43/647 (2006.01)	A 0 1 N 43/80	1 0 1
A 0 1 P 3/00 (2006.01)	A 0 1 N 43/82	1 0 4
	A 0 1 N 43/647	
	A 0 1 P 3/00	

(81)指定国 AP(BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, T J, TM), EP(AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, R O, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, H U, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI , NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN

(74)代理人 100137213

弁理士 安藤 健司

(74)代理人 230105223

弁護士 城山 康文

(72)発明者 ベンディング, ユルゲン

ドイツ国、4 2 7 9 9・ライヒリンゲン、アムゼルシュトラッセ・7

(72)発明者 クリストー, ピエール

フランス国、エフ - 6 9 0 0 9・リヨン、リュ・マリートン・4

(72)発明者 ダーメン, ペーター

ドイツ国、4 1 4 7 0・ノイス、アルテブルツカー・シュトラッセ・6 3

(72)発明者 デボルド, フィリップ

フランス国、エフ - 6 9 0 0 6・リヨン、リユー・ドウ・ドクトウール・ムイセ・1 4

(72)発明者 ゲーリー, ステファニー

フランス国、エフ - 6 9 4 1 0・シヤンパーニユ - オー - モン - ドール、リユー・シモン・ピユッ
ソン・9

(72)発明者 シュミット, ジアン - ペーター

フランス国、エフ - 6 9 2 3 0 ・ サン - ジュニ - ラバル、 シュマン・デ・ラ・ベゴニエール・3 2

(72)発明者 ヴァツヘンドルフ - ノイマン, ウルリケ

ドイツ国、5 6 5 6 6 ・ ノイヴィート、 オーベラー・マーケンベーク・8 5

F ターム(参考) 4C063 AA01 BB09 CC22 CC29 CC42 CC51 CC58 CC62 CC67 CC75
CC76 CC94 DD06 DD12 DD14 DD22 EE01
4C086 AA01 AA02 AA03 BC36 BC42 BC60 BC69 BC71 BC82 BC84
GA02 GA04 GA07 GA08 GA09 GA10 MA01 MA04 NA14 ZB35
4H011 AA01 BB09 BB10